

WO0114386

Publication Title:

NOVEL ISOINDOLE DERIVATIVES

Abstract:

This invention relates to compounds represented by the general formula $\text{--}\ddot{\text{N}}\text{--}\text{C}(=\text{O})\text{--}\text{R}\text{--}\text{C}(=\text{O})\text{--}\text{R}'\text{--}\text{C}(=\text{O})\text{--}\text{R}''\text{--}\text{C}(=\text{O})\text{--}\text{R}'''$ wherein, R represents an azido group, etc., R<1> and R<2> are the same or different and represent hydrogen atoms, etc., R<3> and R<4> are the same or different and represent hydrogen atoms, etc., X₁ represents an oxygen atom, etc., X₂ represents an oxygen atom, etc., Y represents an oxygen atom, etc., and Z represents a condensed aryl group, etc., or a pharmaceutically acceptable salt thereof, preparation processes thereof, and an agent for treating diabetes, a prophylactic agent for chronic complications of diabetes or a drug against obesity, containing, as an effective ingredient, the compound or the pharmaceutically acceptable salt thereof.

Data supplied from the esp@cenet database - <http://ep.espacenet.com>

(12)特許協力条約に基づいて公開された国際出願

(19) 世界知的所有権機関
国際事務局



(43) 国際公開日
2001年3月1日 (01.03.2001)

PCT

(10) 国際公開番号
WO 01/14386 A1

(51) 国際特許分類: C07D 491/048, 491/147,
487/04, 471/14, 487/14, 513/04, 513/14, 498/14, 498/04,
A61K 31/424, 31/437, 31/4188, 31/4985, 31/407, 31/519,
31/5377, 31/4439, 31/429, 31/5025, A61P 3/10, 3/04

Jun-ichi) [JP/JP]; 〒300-2611 茨城県つくば市大久保3
番地 萬有製薬株式会社 つくば研究所内 Ibaraki (JP).

(21) 国際出願番号: PCT/JP00/05723

(74) 共通の代表者: 萬有製薬株式会社 (BANYU PHARMACEUTICAL CO., LTD.); 〒103-8416 東京都中央区日本橋本町2丁目2番3号 Tokyo (JP).

(22) 国際出願日: 2000年8月25日 (25.08.2000)

(81) 指定国(国内): AE, AG, AL, AM, AU, AZ, BA, BB, BG,
BR, BY, BZ, CA, CN, CR, CU, CZ, DM, DZ, EE, GD, GE,
HR, HU, ID, IL, IN, IS, KG, KR, KZ, LC, LK, LR, LT, LV,
MA, MD, MG, MK, MN, MX, MZ, NO, NZ, PL, RO, RU,
SG, SI, SK, TJ, TM, TR, TT, UA, US, UZ, VN, YU, ZA.

(25) 国際出願の言語: 日本語

(26) 国際公開の言語: 日本語

(84) 指定国(広域): ARIPO 特許 (GH, GM, KE, LS, MW,
MZ, SD, SL, SZ, TZ, UG, ZW), ユーラシア特許 (AM,
AZ, BY, KG, KZ, MD, RU, TJ, TM), ヨーロッパ特許
(AT, BE, CH, CY, DE, DK, ES, FI, FR, GB, GR, IE, IT,
LU, MC, NL, PT, SE), OAPI 特許 (BF, BJ, CF, CG, CI,
CM, GA, GN, GW, ML, MR, NE, SN, TD, TG).

(30) 優先権データ:
特願平11/239004 1999年8月25日 (25.08.1999) JP

添付公開書類:
— 國際調査報告書

(71) 出願人(米国を除く全ての指定国について): 萬有製薬
株式会社 (BANYU PHARMACEUTICAL CO., LTD.)
[JP/JP]; 〒103-8416 東京都中央区日本橋本町2丁目2
番3号 Tokyo (JP).

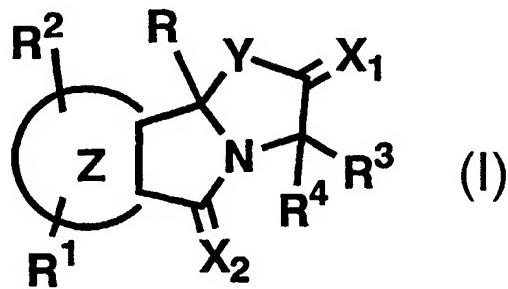
2文字コード及び他の略語については、定期発行される
各PCTガゼットの巻頭に掲載されている「コードと略語
のガイダンスノート」を参照。

(72) 発明者; および

(75) 発明者/出願人(米国についてのみ): 長瀬敏雄 (NAGASE, Toshio) [JP/JP]. 飯野智晴 (IINO, Tomoharu) [JP/JP]. 佐藤禎之 (SATO, Yoshiyuki) [JP/JP]. 西村輝之 (NISHIMURA, Teruyuki) [JP/JP]. 永木淳一 (EIKI,

(54) Title: NOVEL ISOINDOLE DERIVATIVES

(54) 発明の名称: 新規なイソインドール誘導体



(57) Abstract: Compounds represented by general formula [I] or pharmaceutically acceptable salts thereof; a process for producing the same; and remedies for diabetes, preventives for complication of diabetes or antibacterial agents containing as the active ingredient the above compounds or pharmaceutically acceptable salts thereof in said formula, R represents azido, etc.; R¹ and R² are the same or different and each represents hydrogen, etc.; R³ and R⁴ are the same or different and each represents hydrogen, etc.; X₁ represents oxygen, etc.; X₂ represents oxygen, etc.; Y represents oxygen, etc.; and Z represents fused aryl, etc.

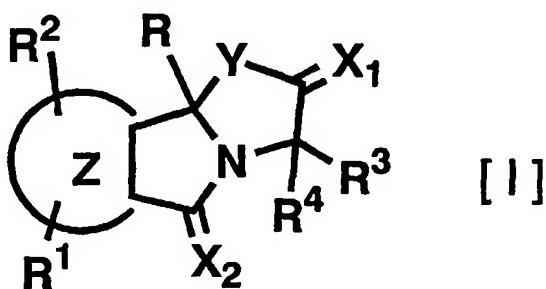
WO 01/14386 A1

/統葉有/



(57) 要約:

本発明は、一般式 [I]



[式中、Rは、アジド等、R¹及びR²は、同一又は異なって水素原子等、R³及びR⁴は、同一又は異なって水素原子等、X₁は、酸素原子等、X₂は、酸素原子等、Yは、酸素原子等、Zは、縮合アリール基等を示す]で表される化合物又はその医薬上許容される塩、その製造法及び該化合物又はその医薬上許容される塩を有効成分として含有する糖尿病治療剤、糖尿病の慢性合併症の予防剤又は抗肥満剤に関するものである。

明 細 書

新規なイソインドール誘導体

5 技 術 分 野

本発明は、医薬品として有用な新規なイソインドール誘導体、その製造法及びその用途に関するものである。

背 景 技 術

10 健常人の血糖値は、インスリンの作用により、一定にコントロールされている。糖尿病とは、このコントロールが効かなくなり慢性的に高血糖状態を呈すること及びそのことによって引き起こされる疾患をいう。
糖尿病治療の根本は高血糖状態の是正、すなわち血中グルコース濃度を正常値に戻すことがあるが、近年では特に、空腹時血糖に影響を与えることなく、食後
15 の急激な血糖値の上昇を如何に抑えるかという点が治療上極めて重要であると認識されてきている。

現在、臨床現場において使用されている主な糖尿病治療薬は、各種インスリン製剤の他に大別して以下の三種類の治療薬が存在する。第1はスルホニルウレア剤に代表されるインスリン放出薬と呼ばれる薬剤群で、この薬剤は膵臓から直接
20 インスリン分泌を促進し血糖値を下げるものである。第2は近年上市されたインスリン抵抗性改善剤と呼ばれるもので、この薬剤は直接インスリン放出を助長することなく、末梢組織での糖の取り込みを促進することにより血糖値を下げる薬剤である。第3の α -グルコシダーゼ阻害剤は、消化管における糖質の消化、吸収を遅延し、一時的な食後の血糖値の上昇を抑えることにより、血糖値の急激な
25 上昇を制御する薬である。

一方、グルカゴン様ペプチド-1（以下、GLP-1という。）は、食事の刺激等によって、小腸腸管上皮に存在する内分泌細胞であるL細胞から分泌されるホルモンであり、膵臓ランゲルハンス島に存在する β 細胞に作用してインスリン

分泌を促進することにより血糖を降下させることができていている (Eur. J. Clin. Invest. 第22巻、第154頁、1992年)。GLP-1によるインスリン分泌作用は、血糖値に依存しており、正常血糖時ではGLP-1によるインスリン分泌は認められず、高血糖時にのみインスリン分泌の亢進が見られることが報告されている (Lancet 第2巻、第1300頁、1987年)。GLP-1はインスリン分泌を亢進するだけでなく、インスリンの生合成を高め (Endocrinology 第130巻、第159頁、1992年)、また、 β 細胞の増殖を促す (Diabetologia 第42巻、第856頁、1999年) ことから、 β 細胞の維持にとっても欠かすことの出来ない因子である。

一般のI型糖尿病患者へのGLP-1投与によって血中GLP-1濃度を高値に維持した結果、高血糖状態が有意に改善されることが示されており、医療現場においてもその糖尿病に対しての有効性が確認されている (Diabetologia 第36巻、第741頁、1994年又は同、第39巻、第1546頁、1996年)

さらには、GLP-1の作用点は β 細胞だけにとどまらず、末梢組織において糖の利用を亢進することが認められ (Endocrinology 第135巻、第2070頁、1994年又はDiabetologia 第37巻、第1163頁、1994年)、また、GLP-1の脳室内投与により摂食抑制作用を示すとの報告がなされている (Digestion 第54巻、第360頁、1993年)。さらに、GLP-1投与により消化管運動抑制作用があることも報告されている (Dig. Dis. Sci. 第43巻、第1113頁、1998年)。

本発明の化合物と構造が最も近似する化合物は、米国特許第4717414号公報 (以下、引例Aという。) 及びJ. Chem. Soc., Perkin Trans. 1、第1547頁、1979年 (以下、引例Bという。) に記載されている。

引例Aの化合物は、イソインドール骨格に縮合するイミダゾ部分にオキソ基を有するイミダゾイソインドールジオン骨格を有している。

しかしながら、本発明の化合物は、イミダゾイソインドールジオン骨格は引

- 例Aの化合物と共にするものの、該骨格上9位置換基部分に、例えばアリール基等の官能基を有する点で、置換アルキル基 ($R^4C(Z)R^5$)、具体的には例えばニトロメチル基、1-ニトロ-1-エチルメチル基等を有する引例Aの化合物とは、全く構造が異なる化合物である。また、引例Aの用途は、除草剤であり、
- 5 本発明とは、産業上の利用分野が異なる全く関連性のない用途である。さらには、引例Aの製法は、ジヒドロイミダゾイソインドールジオン等へのアルキル炭素アニオン等の求核反応によるものであり、環形成反応を伴う本発明の製法とは、全く異なる製法である。

引例Bには、イソインドール骨格に縮合するオキサゾロ部分にオキソ基を有するオキサゾロイソインドールジオン骨格を有する化合物が記載されている。

しかしながら、引例Bはイソインドロベンズアゼピン誘導体の新規な製造法を主要に開示しており、その反応工程において、反応副生物として、オキサゾロイソインドールジオン骨格を有する化合物が唯一生成されることを開示するに過ぎない。本発明の化合物は、オキサゾロイソインドールジオン骨格は引例Bに記載の化合物と共にするものの、該骨格上9位置換基部分に、例えばアリール基等の官能基を有する点で、置換基が α -プロモベンジル基である化合物(11)である引例Bの化合物とは、全く構造が異なる化合物である。

また、特表平6-507388号公報(以下、引例Cという。)及び米国特許第3507863号公報(以下、引例Dという。)には、6員環、5員環及び5員環が縮合した3環性の複素芳香環が記載されている。

引例Cには、イソインドール骨格にオキサゾロ部分又はイミダゾ部分が縮合したオキサゾロイソインドール骨格及びイミダゾイソインドール骨格を有する化合物が記載されている。

しかしながら、本発明の化合物は、オキサゾロイソインドール骨格あるいはイミダゾイソインドール骨格は引例Cの化合物と共にするものの、イソインドール骨格に縮合するオキサゾロ部分又はイミダゾ部分に、例えばオキソ基又はチオキソ基等の官能基を有する点で、該オキソ基等を有さない引例Cの化合物とは、全く構造が異なる化合物である。また、引例Cの用途は、抗ウイルス性医薬品であり、産業上の利用分野は同じであるが、本発明の用途とは全く関連性のない用途

である。

引例Dには、イソインドール骨格にオキサゾロ部分、イミダゾ部分又はチアゾロ部分が縮合したオキサゾロイソインドール骨格、イミダゾイソインドール骨格又はチアゾロイソインドール骨格を有する化合物が記載されている。

- 5 しかしながら、本発明の化合物は、オキサゾロイソインドール骨格、イミダゾイソインドール骨格及びチアゾロイソインドール骨格は引例Dの化合物と共通するものの、イソインドール骨格に縮合するオキサゾロ部分、イミダゾ部分又はチアゾロ部分に、例えばオキソ基又はチオキソ基等の官能基を有する点で、該オキソ基等を有さない引例Dの化合物とは、全く構造が異なる化合物である。また、
10 引例Dの用途は、抗炎症薬又は抗痙攣薬であり、産業上の利用分野は同じであるが、本発明の用途とは全く関連性のない用途である。

- 本発明の用途に関連する発明を開示する先行技術としては、米国特許第3928597号公報（以下、引例Eという。）が挙げられる。引例Eは、イソインドール骨格に縮合するイミダゾ部分に低級アルキル基が置換した2,3-ジヒドロイミダゾイソンドロール化合物とイミダゾリルフェニルフェニルケトン化合物とを経口又は非経口投与することを特徴とする抗高血糖症の治療方法の発明である。

- 20 しかしながら、本発明化合物は、イミダゾイソンドロン骨格は引例Eの化合物と共通するものの、イソインドール骨格に縮合するイミダゾ部分に、例えばオキソ基又はチオキソ基等の官能基を有する点で、該オキソ基等を有さない引例Eの化合物とは、全く構造が異なる化合物である。その上、引例Eの発明の特徴は、明細書第4欄第39行目から第45行目に記載されているように、単独では高血糖効果作用を示さない、2,3-ジヒドロイミダゾイソンドロール化合物及びイミダゾリルフェニルフェニルケトン化合物を共に投与することにより達成された、この2種類の化合物の相互作用による用途発明であり、本発明とは、発明の主旨が本質的に異なるものである。

現在では、糖尿病治療薬として、例えばスルホニルウレア剤、インスリン抵抗性改善剤、 α -グルコシダーゼ阻害剤等の薬剤が臨床で多く用いられているが、以下のような問題点が挙げられ、これらは十分な薬剤であるといえない。すなわ

ち、スルホニルウレア剤は、効果の発現が遅くしかも作用持続時間が長いため、食後の高血糖時に合わせ作用を発現させるのが難しく、さらには空腹時の血糖を降下させしばしば生命にかかわるような重篤な低血糖発作を引き起こす場合もある。インスリン抵抗性改善剤は、肝臓に対する副作用がしばしば問題となっており、厳密な管理下における慎重な使用が必要となっている。また浮腫等の副作用を引き起こす場合もある。また、 α -グルコシダーゼ阻害剤には、膨満感や下痢などの副作用が問題となっている。

したがって、昨今の糖尿病患者の増加に伴い、現在、副作用がなく、血糖値に依存して血糖値を制御できる一層有益な糖尿病治療薬の開発が臨床の現場から求められている。

発明の開示

本発明者らは、血糖値に依存して血糖値を制御できる糖尿病治療薬、糖尿病の慢性合併症の予防剤又は抗肥満薬の創製を目的に鋭意研究を進めてきたところ、一般式〔I〕の化合物が生体内において高い血中G L P - 1 濃度を達成することを見出し、本発明を完成した。

本発明は、イソインドール誘導体、その製造法及びその用途に関するものであり、これらの発明は、文献に未記載の新規なものである。

次に本明細書中に記載された各種記号及び用語の定義について説明する。
アリール基としては、炭素数6ないし15個よりなるアリール基が好ましく、例えばナフチル基、フェニル基等が挙げられ、中でも例えばフェニル基等が好ましい。

1ないし3環性のC₇—C₁₅炭素芳香環基としては、炭素数7ないし15個を含む1ないし3の環状基を含む芳香環基が好ましく、例えばアセナフチレン基、アダマンチル基、アンスリル基、インデニル基、ノルボルニル基、フェナンスリル基等が挙げられ、中でも例えばアンスリル基、フェナンスリル基等が好ましい。

5又は6員のヘテロ環基としては、例えばイソオキサゾリル基、イソチアゾリル基、イミダゾリル基、オキサゾリル基、オキサジアゾリル基、チアゾリル基、チアジアゾリル基、チエニル基、トリアジニル基、トリアゾリル基、ピリジル基、

- ピラジニル基、ピリミジニル基、ピリダジニル基、ピラゾリル基、ピロリル基、
ピラニル基、フリル基、フラザニル基、イミダゾリジニル基、イミダゾリニル基、
テトラヒドロフラニル基、ピラゾリジニル基、ピラゾリニル基、ピペラジニル基、
ピペリジニル基、ピロリジニル基、ピロリニル基、モルホリノ基等が挙げられ、
5 中でも例えばチエニル基、テトラヒドロフラニル基、ピリジル基、ピラジニル基、
ピリミジニル基、フリル基、モルホリノ基等が好ましい。
- 窒素原子、酸素原子及び硫黄原子からなる群より選ばれるヘテロ原子を1環系
当たり1ないし5個有する1ないし3環性の複素芳香環基としては、例えばアクリジニル基、イソキノリル基、イソインドリル基、インダゾリル基、インドリル
10 基、インドリジニル基、エチレンジオキシフェニル基、カルバゾリル基、キナゾリニル基、キノキサリニル基、キノリジニル基、キノリル基、クマロニル基、クロメニル基、フェナンスリジニル基、フェナンスロリニル基、ジベンゾフラニル基、ジベンゾチオフェニル基、シンノリニル基、チオナフテニル基、ナフチリジニル基、フェナジニル基、フェナキサジニル基、フェノチアジニル基、フタラジニル基、ブテリジニル基、ブリニル基、ベンゾイミダゾリル基、ベンゾオキサゾリル基、ベンゾチアゾリル基、ベンゾトリアゾリル基、ベンゾフラニル基、メチレンジオキシフェニル基等が挙げられ、中でも例えばエチレンジオキシフェニル基、ジベンゾフラニル基、ジベンゾチオフェニル基、メチレンジオキシフェニル基等が好ましい。
15 20 ハロゲン原子とは、例えばフッ素原子、塩素原子、臭素原子又はヨウ素原子を意味し、中でも例えばフッ素原子、塩素原子、ヨウ素原子等が好ましく、例えばフッ素原子、塩素原子等がより好ましい。
- 環状の飽和C₃–C₉脂肪族基としては、炭素数3ないし9個よりなる環状のアルキル基等が好ましく、中でも例えば炭素数3ないし6個なる環状のアルキル基等が好適である。
25 該環状のアルキル基としては、例えばシクロプロピル基、シクロブチル基、シクロペンチル基、シクロヘキシル基、シクロヘプチル基、シクロオクチル基、シクロノニル基等が挙げられ、中でも例えばシクロプロピル基、シクロブチル基、シクロペンチル基、シクロヘキシル基等が好ましい。

環状の不飽和C₃～C₉脂肪族基としては、炭素数3ないし9個よりなる環状のアルケニル基等が好ましく、中でも例えば炭素数3ないし6個なる環状のアルケニル基等が好適である。

該環状のアルケニル基としては、例えばシクロプロペニル基、シクロブテニル基、シクロペンテニル基、シクロヘキセニル基、シクロヘプテニル基、シクロオクテニル基、シクロノネニル基等が挙げられ、中でも例えばシクロプロペニル基、シクロブテニル基、シクロペンテニル基、シクロヘキセニル基等が好ましい。

アラルキル基としては、炭素数7～15個よりなるアラルキル基が好ましく、具体的には例えばベンジル基、α-メチルベンジル基、フェネチル基、3-フェニルプロピル基、1-ナフチルメチル基、2-ナフチルメチル基、α-メチル(1-ナフチル)メチル基、α-メチル(2-ナフチル)メチル基、α-エチル(1-ナフチル)メチル基、α-エチル(2-ナフチル)メチル基、ジフェニルメチル基等、ジナフチルメチル基等が挙げられ、特に例えばベンジル基、1-ナフチルメチル基、2-ナフチルメチル基、α-メチルベンジル基、フェネチル基等が好ましい。

N-アラルキルアミノ基とは、アミノ基に上記のアラルキル基が置換した基を意味し、具体的には例えばN-ベンジルアミノ基、N-(α-メチルベンジル)アミノ基、N-フェネチルアミノ基、N-(3-フェニルプロピル)アミノ基、N-(1-ナフチルメチル)アミノ基、N-(2-ナフチルメチル)アミノ基、N-[α-メチル(1-ナフチル)メチル]アミノ基、N-[α-メチル(2-ナフチル)メチル]アミノ基、N-[α-エチル(1-ナフチル)メチル]アミノ基、N-[α-エチル(2-ナフチル)メチル]アミノ基、ジフェニルメチルアミノ基、N-(ジナフチルメチル)アミノ基等が挙げられ、特に例えばN-ベンジルアミノ基、N-(α-メチルベンジル)アミノ基、N-フェネチルアミノ基等が好ましい。

N、N-ジアラルキルアミノ基とは、アミノ基に上記のアラルキル基が二置換した基を意味し、具体的には例えばN、N-ジベンジルアミノ基、N、N-ジ(α-メチルベンジル)アミノ基、N、N-ジフェネチルアミノ基、N、N-ジ(3-フェニルプロピル)アミノ基、N、N-ジ(1-ナフチルメチル)アミノ

基、N, N-ジ(2-ナフチルメチル)アミノ基、N, N-ジ[α -メチル(1-ナフチル)メチル]アミノ基、N, N-ジ[α -メチル(2-ナフチル)メチル]アミノ基、N-ベンジル-N-(α -メチルベンジル)アミノ基、N-ベンジル-N-フェネチルアミノ基、N-ベンジル-N-(3-フェニルプロピル)アミノ基等が挙げられ、中でも例えばN, N-ジベンジルアミノ基、N, N-ジ(α -メチルベンジル)アミノ基、N, N-ジフェネチルアミノ基等が好ましい。

アラルキルオキシ基とは、酸素原子に上記のアラルキル基が置換した基を意味し、具体的には例えばベンジルオキシ基、 α -メチルベンジルオキシ基、フェネチルオキシ基、3-フェニルプロポキシ基、1-ナフチルメトキシ基、2-ナフチルメトキシ基、 α -メチル(1-ナフチル)メトキシ基、 α -メチル(2-ナフチル)メトキシ基、 α -エチル(1-ナフチル)メトキシ基、 α -エチル(2-ナフチル)メトキシ基、ジフェニルメトキシ基、ジナフチルメトキシ基等が挙げられ、特に例えばベンジルオキシ基、 α -メチルベンジルオキシ基、フェネチルオキシ基等が好ましい。

アラルキルカルボニル基とは、カルボニル基に上記のアラルキル基が置換した基を意味し、具体的には例えばベンジルカルボニル基、 α -メチルベンジルカルボニル基、フェネチルカルボニル基、3-フェニルプロピルカルボニル基、1-ナフチルメチルカルボニル基、2-ナフチルメチルカルボニル基、 α -メチル(1-ナフチル)メチルカルボニル基、 α -メチル(2-ナフチル)メチルカルボニル基、 α -エチル(1-ナフチル)メチルカルボニル基、 α -エチル(2-ナフチル)メチルカルボニル基、ジフェニルメチルカルボニル基、ジナフチルメチルカルボニル基等が挙げられ、特に例えばベンジルカルボニル基、 α -メチルベンジルカルボニル基、フェネチルカルボニル基等が好ましい。

N-アラルキルカルバモイル基とは、カルバモイル基に上記のアラルキル基が置換した基を意味し、具体的には例えばN-ベンジルカルバモイル基、N-(α -メチルベンジル)カルバモイル基、N-フェネチルカルバモイル基、N-(3-フェニルプロピル)カルバモイル基、N-(1-ナフチルメチル)カルバモイル基、N-(2-ナフチルメチル)カルバモイル基、N-(α -メチル(1-ナフチル)メチル)カルバモイル基、N-(α -メチル(2-ナフチル)メチル)カルバモイル基、N-(α -メチル(2-ナフチル)メチル)カルバモイル基、N-(α -メチル(2-ナフチル)メチル)カルバモイル基等が挙げられる。

- ルバモイル基、N-(α -エチル(1-ナフチル)メチル)カルバモイル基、N-(α -エチル(2-ナフチル)メチル)カルバモイル基、N-(ジフェニルメチル)カルバモイル基、N-(ジナフチルメチル)カルバモイル基等が挙げられ、特に例えばN-ベンジルカルバモイル基、N-(α -メチルベンジル)カルバモイル基、N-フェネチルカルバモイル基等が好ましい。
- N-アリールアミノ基とは、アミノ基に上記のアリール基が置換した基を意味し、具体的には例えばN-フェニルアミノ基、N-(1-ナフチル)アミノ基、N-(2-ナフチル)アミノ基等が挙げられ、中でも例えばN-フェニルアミノ基等が好ましい。
- N, N-ジアリールアミノ基とは、アミノ基に上記のアリール基が二置換した基を意味し、具体的には例えばN, N-ジフェニルアミノ基、N, N-ジ(1-ナフチル)アミノ基、N, N-ジ(2-ナフチル)アミノ基、N-フェニル-N-(1-ナフチル)アミノ基、N-フェニル-N-(2-ナフチル)アミノ基、N-(1-ナフチル)-N-(2-ナフチル)アミノ基等が挙げられ、中でも例えばN, N-ジフェニルアミノ基、N, N-ジ(1-ナフチル)アミノ基、N, N-ジ(2-ナフチル)アミノ基等が好ましい。
- アリールオキシ基とは、酸素原子に上記のアリール基が置換した基を意味し、具体的には例えばフェノキシ基、ナフチルオキシ基等が挙げられ、中でも例えばフェノキシ基等が好ましい。
- アリールスルホニル基とは、スルホニル基に上記のアリール基が置換した基を意味し、具体的には例えばフェニルスルホニル基、ナフチルスルホニル基等が挙げられ、中でも例えばフェニルスルホニル基等が好ましい。
- アリールスルホニルオキシ基とは、スルホニルオキシ基に上記のアリール基が置換した基を意味し、具体的には例えばフェニルスルホニルオキシ基、ナフチルスルホニルオキシ基等が挙げられ、中でも例えばフェニルスルホニルオキシ基等が好ましい。
- N-アリールスルホニルアミノ基とは、アミノ基に上記のアリールスルホニル基がN-置換した基を意味し、具体的には例えばN-フェニルスルホニルアミノ基、N-(1-ナフチルスルホニル)アミノ基、N-(2-ナフチルスルホニル)

アミノ基等が挙げられ、中でも例えばN-フェニルスルホニルアミノ基、N-(2-ナフチルスルホニル)アミノ基等が好ましい。

N-アリールスルホニルアミノC₁-C₁₀アルキルアミノ基としては、アミノ基に上記のアリールスルホニルアミノ基を有する炭素数1ないし10個よりなる

- 5 アルキル基がN-置換した基が好ましく、具体的には例えばN-フェニルスルホニルアミノメチルアミノ基、N-(1-フェニルスルホニルアミノエチル)アミノ基、N-(2-フェニルスルホニルアミノエチル)アミノ基、N-(1-ナフチルスルホニルアミノエチル)アミノ基、N-(2-ナフチルスルホニルアミノエチル)アミノ基等が挙げられ、
10 中でも例えばN-フェニルスルホニルアミノメチルアミノ基、N-(2-フェニルスルホニルアミノエチル)アミノ基等が好ましい。

N-アリールスルホニルアミノC₁-C₁₀アルキルカルバモイル基としては、カルバモイル基に上記のアリールスルホニルアミノ基を有する炭素数1ないし10個よりなるアルキル基がN-置換した基が好ましく、具体的には例えばN-

- 15 フェニルスルホニルアミノメチルカルバモイル基、N-(1-フェニルスルホニルアミノエチル)カルバモイル基、N-(2-フェニルスルホニルアミノエチル)カルバモイル基、N-ナフチルスルホニルアミノメチルカルバモイル基、N-(1-ナフチルスルホニルアミノエチル)カルバモイル基、N-(2-ナフチルスルホニルアミノエチル)カルバモイル基等が挙げられ、中でも例えばN-フェニルスルホニルアミノメチルカルバモイル基、N-(2-フェニルスルホニルアミノエチル)カルバモイル基、N-(2-ナフチルスルホニルアミノエチル)カルバモイル基等が好ましい。

N-アリールスルホニルアミノC₁-C₆アルコキシカルボニル基としては、上記のN-アリールスルホニルアミノ基が炭素数1ないし6個よりなるアルコキシ

- 25 カルボニル基に置換した基が好ましく、具体的には例えばN-フェニルスルホニルアミノメトキシカルボニル基、N-ナフチルスルホニルアミノメトキシカルボニル基、1-(N-フェニルスルホニルアミノ)エトキシカルボニル基、2-(N-フェニルスルホニルアミノ)エトキシカルボニル基等が挙げられ、中でも例えばN-フェニルスルホニルアミノメトキシカルボニル基、N-ナフチルスル

ホニルアミノメトキシカルボニル基等が好ましい。

アリールスルファモイル基とは、スルファモイル基に上記のアリール基が置換した基を意味し、具体的には例えばフェニルスルファモイル基、ナフチルスルファモイル基等が挙げられ、中でも例えばフェニルスルファモイル基等が好ましい。

- 5 アリールスルファモイルオキシ基とは、スルファモイルオキシ基に上記のアリール基が置換した基を意味し、具体的には例えばフェニルスルファモイルオキシ基、ナフチルスルファモイルオキシ基等が挙げられ、中でも例えばフェニルスルファモイルオキシ基等が好ましい。

- 10 N-アリールスルファモイルC₁-C₁₀アルキルカルバモイル基としては、上記のアリールスルファモイルが炭素数1ないし10個よりなるアルキルカルバモイル基に置換した基が好ましく、具体的には例えばフェニルスルファモイルメチルカルバモイル基、N-ナフチルスルファモイルメチルカルバモイル基等が挙げられ、中でも例えばN-フェニルスルファモイルメチルカルバモイル基等が好ましい。

- 15 アリールスルファモイルC₁-C₆アルコキシカルボニル基としては、上記のアリールスルファモイルが炭素数1ないし6個よりなるアルコキシカルボニル基に置換した基が好ましく、具体的には例えばフェニルスルファモイルメトキシカルボニル基、ナフチルスルファモイルメトキシカルボニル基等が挙げられ、中でも例えばフェニルスルファモイルメトキシカルボニル基等が好ましい。

- 20 N-アリールカルバモイル基とは、上記のアリール基がカルバモイル基にN-置換した基を意味し、具体的には例えばフェニルカルバモイル基、ナフチルカルバモイル基等が挙げられ、中でも例えばフェニルカルバモイル基等が好ましい。

- 25 C₂-C₆アルカノイル基としては、カルボニル基に炭素数1ないし5個よりなるアルキル基が置換した基が好ましく、具体的には例えばアセチル基、プロピオニル基、ブチリル基、イソブチリル基、バレリル基、イソバレリル基、ピバロイル基、ペンタノイル基等が挙げられ、中でも例えばアセチル基、プロピオニル基、ピバロイル基等が好ましい。

N-C₂-C₆アルカノイルアミノ基とは、アミノ基に上記のC₂-C₆アルカノイル基が置換した基を意味し、具体的には例えばN-アセチルアミノ基、N-プロ

ロピオニルアミノ基、N-ブチリルアミノ基、N-イソブチリルアミノ基、N-バレリルアミノ基、N-イソバレリルアミノ基、N-ビバロイルアミノ基、N-ペンタノイルアミノ基等が挙げられ、中でも例えばN-アセチルアミノ基、N-プロピオニルアミノ基、N-ビバロイルアミノ基等が好ましい。

- 5 N, N-ジC₂-C₆アルカノイルアミノ基とは、アミノ基に上記のC₂-C₆アルカノイル基が二置換した基を意味し、具体的には例えばN, N-ジアセチルアミノ基、N, N-ジプロピオニルアミノ基、N, N-ジブチリルアミノ基、N, N-ジイソブチリルアミノ基、N, N-ジバレリルアミノ基、N, N-ジイソバレリルアミノ基、N, N-ジビバロイルアミノ基、N, N-ジペンタノイルアミ
- 10 10ノ基、N-アセチル-N-プロピオニルアミノ基、N-アセチル-N-ブチリルアミノ基、N-アセチル-N-ビバロイルアミノ基等が挙げられ、中でも例えばN, N-ジアセチルアミノ基、N, N-ジプロピオニルアミノ基、N, N-ジブチリルアミノ基、N, N-ジビバロイルアミノ基等が好ましい。

アロイル基とは、カルボニル基に上記のアリール基が置換した基を意味し、具体的には例えばベンゾイル基、ナフチルカルボニル基等が挙げられ、中でも例えばベンゾイル基等が好ましい。

アロキシ基とは、上記のアロイル基が酸素原子に置換した基を意味し、具体的には例えばベンゾイルオキシ基、ナフチルカルボニルオキシ基等が挙げられ、中でも例えばベンゾイルオキシ基等が好ましい。

- 20 N-アロイルアミノ基とは、アミノ基に上記のアロイル基がN-置換した基を意味し、具体的には例えばN-ベンゾイルアミノ基、N-ナフチルカルボニルアミノ基等が挙げられ、中でも例えばN-ベンゾイルアミノ基等が好ましい。

N-アロイルC₁-C₁₀アルキルアミノ基としては、アミノ基に上記のアロイル基を有する炭素数1ないし10個よりなるアルキル基がN-置換した基が好ましく具体的には例えばN-ベンゾイルメチルアミノ基、N-(1-ベンゾイルエチル)アミノ基、N-(2-ベンゾイルエチル)アミノ基、N-ナフチルカルボニルアミノ基、N-(1-ナフチルカルボニルエチル)アミノ基、N-(2-ナフチルカルボニルエチル)アミノ基等が挙げられ、中でも例えばN-ベンゾイルメチルアミノ基、N-(2-ベンゾイルエチル)アミノ基等が好ましい。

N-アロイルC₁-C₁₀アルキルカルバモイル基とは、カルバモイル基に上記のN-アロイルC₁-C₁₀アルキル基が置換した基を意味し、具体的には例えばN-ベンゾイルメチルカルバモイル基、N-(1-ベンゾイルエチル)カルバモイル基、N-(2-ベンゾイルエチル)カルバモイル基、N-ナフチルメチルカルボニルカルバモイル基、N-(1-ナフチルカルボニルエチル)カルバモイル基、N-(2-ナフチルカルボニルエチル)カルバモイル基等が挙げられ、中でも例えばN-ベンゾイルメチルカルバモイル基、N-(2-ベンゾイルエチル)カルバモイル基等が好ましい。

N-(N-アロイルアミノ)C₁-C₁₀アルキルカルバモイル基とは、カルバモイル基に上記のN-アロイルアミノC₁-C₁₀アルキル基が置換した基を意味し、具体的には例えばN-(N-ベンゾイルアミノメチル)カルバモイル基、N-(1-(N-ベンゾイルアミノ)エチル)カルバモイル基、N-(2-(N-ベンゾイル)アミノエチル)カルバモイル基、N-(N-ナフチルカルボニルアミノメチル)カルバモイル基、N-(1-(N-ナフチルカルボニルアミノ)エチル)カルバモイル基、N-(2-(N-ナフチルカルボニルアミノ)エチル)カルバモイル基等が挙げられ、中でも例えばN-(N-ベンゾイルアミノメチル)カルバモイル基、N-(2-(N-ベンゾイルアミノ)エチル)カルバモイル基等が好ましい。

N-アロイルアミノC₁-C₁₀アルコキシカルボニル基とは、オキシカルボニル基に上記のN-アロイルアミノC₁-C₁₀アルキル基が置換した基を意味し、具体的には例えばN-ベンゾイルアミノメトキシカルボニル基、1-(N-ベンゾイルアミノ)エトキシカルボニル基、2-(N-ベンゾイルアミノ)エトキシカルボニル基、N-ナフチルカルボニルアミノメトキシカルボニル基、1-(N-ナフチルカルボニルアミノ)エトキシカルボニル基、2-(N-ナフチルカルボニルアミノ)エトキシカルボニル基等が挙げられ、中でも例えばN-ベンゾイルアミノメトキシカルボニル基、2-(N-ベンゾイルアミノ)エトキシカルボニル基等が好ましい。

N-C₁-C₆アルキルアミノ基としては、アミノ基に炭素数1ないし6個よりなるアルキル基がN-置換した基が好ましく、具体的には例えばN-メチルアミ

- ノ基、N-エチルアミノ基、N-プロピルアミノ基、N-イソプロピルアミノ基、
 N-ブチルアミノ基、N-イソブチルアミノ基、N-sec-ブチルアミノ基、
 N-tert-ブチルアミノ基、N-ペンチルアミノ基、N-ネオペンチルアミ
 ノ基、N-ヘキシルアミノ基、N-イソヘキシルアミノ基等が挙げられ、中でも
 5 例えばN-メチルアミノ基、N-エチルアミノ基、N-プロピルアミノ基、N-
 イソプロピルアミノ基、N-ブチルアミノ基、N-イソブチルアミノ基、N-tert-
 ブチルアミノ基等が好ましい。
- N, N-ジ-C₁-C₆アルキルアミノ基としては、アミノ基に炭素数1ないし
 6個よりなるアルキル基がN, N-二置換した基が好ましく、具体的には例えば
 10 N, N-ジメチルアミノ基、N, N-ジエチルアミノ基、N, N-ジプロピルア
 ミノ基、N, N-ジイソプロピルアミノ基、N, N-ジブチルアミノ基、N, N-
 ジtert-ブチルアミノ基、N, N-ジペンチルアミノ基、N, N-ジヘキシ
 ルアミノ基、N-エチル-N-メチルアミノ基、N-メチル-N-プロピルア
 ミノ基、N-イソプロピル-N-メチルアミノ基、N-tert-ブチル-N-メ
 15 チルアミノ基、N-エチル-N-イソプロピルアミノ基等が挙げられ、中でも例
 えばN, N-ジメチルアミノ基、N, N-ジエチルアミノ基、N, N-ジイソプロ
 ピルアミノ基、N, N-ジブチルアミノ基、N, N-ジtert-ブチルア
 ミノ基、N-エチル-N-メチルアミノ基、N-メチル-N-プロピルアミノ基、
 N-イソプロピル-N-メチルアミノ基、N-エチル-N-イソプロピルアミ
 基等が好ましい。
- 20 N-C₁-C₁₀アルキルカルバモイル基としては、カルバモイル基に炭素数1
 ないし10個よりなるアルキル基がN-置換した基が好ましく、具体的には例え
 ばN-メチルカルバモイル基、N-エチルカルバモイル基、N-プロピルカルバ
 モイル基、N-イソプロピルカルバモイル基、N-ブチルカルバモイル基、N-
 25 イソブチルカルバモイル基、N-sec-ブチルカルバモイル基、N-tert-
 ブチルカルバモイル基、N-ペンチルカルバモイル基、N-ネオペンチルカルバ
 モイル基、N-ヘキシルカルバモイル基、N-イソヘキシルカルバモイル基、N-
 オクチルカルバモイル基、N-デシルカルバモイル基等が挙げられ、中でも例え
 ばN-メチルカルバモイル基、N-エチルカルバモイル基、N-プロピルカルバ

N-C₁-C₁₀アルキルカルバモイル基としては、カルバモイル基に炭素数1
 ないし10個よりなるアルキル基がN-置換した基が好ましく、具体的には例え
 ばN-メチルカルバモイル基、N-エチルカルバモイル基、N-プロピルカルバ
 モイル基、N-イソプロピルカルバモイル基、N-ブチルカルバモイル基、N-
 イソブチルカルバモイル基、N-sec-ブチルカルバモイル基、N-tert-
 ブチルカルバモイル基、N-ペンチルカルバモイル基、N-ネオペンチルカルバ
 モイル基、N-ヘキシルカルバモイル基、N-イソヘキシルカルバモイル基、N-
 オクチルカルバモイル基、N-デシルカルバモイル基等が挙げられ、中でも例え
 ばN-メチルカルバモイル基、N-エチルカルバモイル基、N-プロピルカルバ

モイル基、N-イソプロピルカルバモイル基、N-イソブチルカルバモイル基、N-sec-ブチルカルバモイル基、N-tert-ブチルカルバモイル基、N-オクチルカルバモイル基、N-デシルカルバモイル基等が好ましい。

- N, N-ジ-C₁-C₁₀アルキルカルバモイル基としては、カルバモイル基に
 5 炭素数1ないし10個よりなるアルキル基がN, N-二置換した基が好ましく、具体的には例えばN, N-ジメチルカルバモイル基、N, N-ジエチルカルバモイル基、N, N-ジプロピルカルバモイル基、N, N-ジイソプロピルカルバモイル基、N, N-ジブチルカルバモイル基、N, N-ジtert-ブチルカルバモイル基、N, N-ジペンチルカルバモイル基、N, N-ジヘキシルカルバモ
 10 ル基、N-エチル-N-メチルカルバモイル基、N-イソプロピル-N-メチルカルバモイル基、N-tert-ブチル-N-メチルカルバモイル基、N-エチル-N-イソプロピルカルバモイル基等が挙げられ、中でも例えばN, N-ジメチルカルバモイル基、N, N-ジエチルカルバモイル基、N, N-ジイソプロピルカルバモイル基、N, N-ジブチルカルバモイル基、N, N-ジtert-ブ
 15 チルカルバモイル基、N-エチル-N-メチルカルバモイル基、N-イソプロピル-N-メチルカルバモイル基、N-エチル-N-イソプロピルカルバモイル基等が好ましい。

- N-C₁-C₁₀アルキルチオカルバモイル基としては、チオカルバモイル基に
 炭素数1ないし10個よりなるアルキル基がN-置換した基が好ましく、具体的
 20 には例えばN-メチルチオカルバモイル基、N-エチルチオカルバモイル基、N-プロピルチオカルバモイル基、N-イソプロピルチオカルバモイル基、N-ブチルチオカルバモイル基、N-イソブチルチオカルバモイル基、N-sec-ブチルチオカルバモイル基、N-tert-ブチルチオカルバモイル基、N-ペンチルチオカルバモイル基、N-ネオペンチルチオカルバモイル基、N-ヘキシルチ
 25 オカルバモイル基、N-イソヘキシルチオカルバモイル基、N-オクチルチオカルバモイル基、N-デシルチオカルバモイル基等が挙げられ、中でも例えばN-メチルチオカルバモイル基、N-エチルチオカルバモイル基、N-プロピルチオカルバモイル基、N-イソプロピルチオカルバモイル基、N-イソブチルチオカルバモイル基、N-sec-ブチルチオカルバモイル基、N-tert-ブチル

チオカルバモイル基、N-オクチルチオカルバモイル基、N-デシルチオカルバモイル基等が好ましい。

N, N-ジ-C₁-C₁₀アルキルチオカルバモイル基としては、チオカルバモイル基に炭素数1ないし10個よりなるアルキル基がN, N-二置換した基が好ましく、具体的には例えばN, N-ジメチルチオカルバモイル基、N, N-ジエチルチオカルバモイル基、N, N-ジプロピルチオカルバモイル基、N, N-ジイソプロピルチオカルバモイル基、N, N-ジブチルチオカルバモイル基、N, N-ジtert-ブチルチオカルバモイル基、N, N-ジペンチルチオカルバモイル基、N, N-ジヘキシルチオカルバモイル基、N-エチル-N-メチルチオカルバモイル基、N-イソプロピル-N-メチルチオカルバモイル基、N-tert-ブチル-N-メチルチオカルバモイル基、N-エチル-N-イソプロピルチオカルバモイル基等が挙げられ、中でも例えばN, N-ジメチルチオカルバモイル基、N, N-ジエチルチオカルバモイル基、N, N-ジイソプロピルチオカルバモイル基、N, N-ジブチルチオカルバモイル基、N, N-ジtert-ブチルチオカルバモイル基、N-エチル-N-メチルチオカルバモイル基、N-イソプロピル-N-メチルチオカルバモイル基、N-エチル-N-イソプロピルチオカルバモイル基等が好ましい。

N-アミノC₁-C₁₀アルキルカルバモイル基としては、カルバモイル基に炭素数1ないし10個よりなるアミノアルキル基がN-置換した基が好ましく、具体的には例えばN-アミノメチルカルバモイル基、N-アミノエチルカルバモイル基、N-アミノプロピルカルバモイル基、N-アミノメチルエチルカルバモイル基、N-アミノブチルカルバモイル基、N-アミノプロピルカルバモイル基、N-アミノペンチルカルバモイル基、N-アミノヘキシルカルバモイル基等が挙げられ、中でも例えばN-アミノメチルカルバモイル基、N-アミノエチルカルバモイル基、N-アミノプロピルカルバモイル基、N-アミノメチルエチルカルバモイル基等が好ましい。

N-C₁-C₆アルコキシC₁-C₁₀アルキルカルバモイル基としては、上記のN-C₁-C₁₀アルキルカルバモイル基に炭素数1ないし6個よりなるアルコキシ基が置換した基が好ましく、具体的には例えばN-メトキシメチルカルバモイ

ル基、N-メトキシエチルカルバモイル基、N-メトキシプロピルカルバモイル基、N-メトキシブチルカルバモイル基、N-エトキシペンチルカルバモイル基、N-ブトキシヘキシルカルバモイル基等が挙げられ、中でも例えばN-メトキシメチルカルバモイル基、N-メトキシエチルカルバモイル基、N-メトキシプロピルカルバモイル基、N-メトキシブチルカルバモイル基等が好ましい。

N-C₁-C₆アルコキシカルボニルC₁-C₁₀アルキルカルバモイル基としては、上記のN-C₁-C₁₀アルキルカルバモイル基に炭素数1ないし6個よりなるアルコキシカルボニル基が置換した基が好ましく、具体的には例えばN-メトキシカルボニルメチルカルバモイル基、N-メトキシカルボニルエチルカルバモイル基、N-メトキシカルボニルプロピルカルバモイル基、N-メトキシカルボニルブチルカルバモイル基、N-エトキシカルボニルペンチルカルバモイル基、N-ブトキシカルボニルヘキシルカルバモイル基、N-tert-ブトキシカルボニルエチルカルバモイル基等が挙げられ、中でも例えばN-メトキシカルボニルメチルカルバモイル基、N-メトキシカルボニルエチルカルバモイル基、N-メトキシカルボニルプロピルカルバモイル基、N-メトキシカルボニルブチルカルバモイル基、N-tert-ブトキシカルボニルエチルカルバモイル基等が好ましい。

アミノC₁-C₆アルコキシカルボニル基としては、カルボニル基に炭素数1ないし6個よりなるアミノアルコキシ基が置換した基が好ましく、具体的には例えばアミノメトキシカルボニル基、アミノエトキシカルボニル基、アミノプロポキシカルボニル基、2-アミノ-2-メチルプロポキシカルボニル基、2-アミノメチルエトキシカルボニル基、アミノブトキシカルボニル基、2-アミノプロポキシカルボニル基、アミノペンチルオキシカルボニル基、アミノヘキシルオキシカルボニル基等が挙げられ、中でも例えばアミノメトキシカルボニル基、アミノエトキシカルボニル基、アミノプロポキシカルボニル基、2-アミノメチルエトキシカルボニル基、2-アミノ-2-メチルプロポキシカルボニル基等が好ましい。

N-C₁-C₆アルコキシカルボニルアミノC₁-C₁₀アルキルカルバモイル基としては、上記のN-C₁-C₁₀アルキルカルバモイル基に炭素数1ないし6個

よりなるアルコキシカルボニルアミノ基が置換した基が好ましく、具体的には例えばN-メトキシカルボニルアミノメチルカルバモイル基、N-メトキシカルボニルアミノエチルカルバモイル基、N-メトキシカルボニルアミノプロピルカルバモイル基、N-メトキシカルボニルアミノブチルカルバモイル基、N-エトキシカルボニルアミノペンチルカルバモイル基、N-ブトキシカルボニルアミノヘキシリカルバモイル基、N-tert-ブトキシカルボニルアミノエチルカルバモイル基等が挙げられ、中でも例えばN-メトキシカルボニルアミノメチルカルバモイル基、N-メトキシカルボニルアミノエチルカルバモイル基、N-メトキシカルボニルアミノプロピルカルバモイル基、N-メトキシカルボニルアミノブチルカルバモイル基、N-tert-ブトキシカルボニルアミノエチルカルバモイル基等が好ましい。

N-C₁-C₆アルコキシカルボニルアミノC₁-C₆アルコキシカルボニル基としては、C₁-C₆アルコキシカルボニル基に炭素数1ないし6個よりなるN-アルコキシカルボニルアミノ基が置換した基が好ましく、具体的には例えばN-メトキシカルボニルアミノメトキシカルボニル基、N-メトキシカルボニルアミノエトキシカルボニル基、N-メトキシカルボニルアミノプロポキシカルボニル基、N-メトキシカルボニルアミノブトキシカルボニル基、N-エトキシカルボニルアミノペンチルオキシカルボニル基、N-ブトキシカルボニルアミノヘキシリオキシカルボニル基、N-tert-ブトキシカルボニルアミノエトキシカルボニル基等が挙げられ、中でも例えばN-メトキシカルボニルアミノメトキシカルボニル基、N-メトキシカルボニルアミノエトキシカルボニル基、N-メトキシカルボニルアミノプロポキシカルボニル基、N-メトキシカルボニルアミノブトキシカルボニル基、N-tert-ブトキシカルボニルアミノエトキシカルボニル基等が好ましい。

N-C₂-C₆アルケニルカルバモイル基としては、カルバモイル基に炭素数2ないし6個よりなるアルケニル基がN-置換した基が好ましく、具体的には例えばN-ビニルカルバモイル基、N-アリルカルバモイル基、N-(1-プロペニル)カルバモイル基、N-イソプロペニルカルバモイル基、N-(2-ブテニル)カルバモイル基、N-イソブテニルカルバモイル基、N-(2-ペンテニル)カルバモイル基、N-イソブテニルカルバモイル基、N-(2-ペンテニル)カルバモイル基等が好ましい。

ルバモイル基、N-(2-ヘキセニル)カルバモイル基、N-(2-ヘプテニル)カルバモイル基、N-(2-オクテニル)カルバモイル基等が挙げられ、中でも例えばN-ビニルカルバモイル基、N-アリルカルバモイル基、N-(1-プロペニル)カルバモイル基等が好ましい。

- 5 N, N-ジ- C_2-C_6 アルケニルカルバモイル基としては、カルバモイル基に炭素数2ないし6個よりなるアルケニル基がN, N-二置換した基が好ましく、具体的には例えばN, N-ジビニルカルバモイル基、N, N-ジアリルカルバモイル基、N, N-ジ(1-プロペニル)カルバモイル基、N, N-ジイソプロペニルカルバモイル基、N-アリル-N-ビニルカルバモイル基、N-アリル-N-10 イソブテニルカルバモイル基、N-アリル-N-(2-ペンテニル)カルバモイル基、N-アリル-N-(2-ヘキセニル)カルバモイル基、N-アリル-N-(2-ヘプテニル)カルバモイル基、N-アリル-N-(2-オクテニル)カルバモイル基等が挙げられ、中でも例えばN-アリル-N-ビニルカルバモイル基、N, N-ジアリルカルバモイル基、N-アリル-N-(1-プロペニル)カルバモイル基等が好ましい。
- 15

- N- C_1-C_6 アルキルスルファモイル基としては、スルファモイル基に炭素数1ないし6個よりなるアルキル基がN-置換した基が好ましく、具体的には例えばN-メチルスルファモイル基、N-エチルスルファモイル基、N-プロピルスルファモイル基、N-イソプロピルスルファモイル基、N-ブチルスルファモイル基、N-イソブチルスルファモイル基、N-s e c -ブチルスルファモイル基、N-t e r t -ブチルスルファモイル基、N-ペンチルスルファモイル基、N-ネオペンチルスルファモイル基、N-ヘキシルスルファモイル基、N-イソヘキシルスルファモイル基等が挙げられ、中でも例えばN-メチルスルファモイル基、N-エチルスルファモイル基、N-イソプロピルスルファモイル基、N-t e r t -ブチルスルファモイル基等が好ましい。

- N, N-ジ- C_1-C_6 アルキルスルファモイル基としては、スルファモイル基に炭素数1ないし6個よりなるアルキル基が二置換した基が好ましく、具体的には例えばN, N-ジメチルスルファモイル基、N, N-ジエチルスルファモイル基、N, N-ジプロピルスルファモイル基、N, N-ジイソプロピルスルファ

モイル基、N, N-ジブチルスルファモイル基、N, N-ジtert-ブチルスルファモイル基、N, N-ジペンチルスルファモイル基、N, N-ジヘキシルスルファモイル基、N-エチル-N-メチルスルファモイル基、N-イソプロピル-N-メチルスルファモイル基、N-tert-ブチル-N-メチルスルファモイル基、N-エチル-N-イソプロピルスルファモイル基等が挙げられ、中でも例えばN, N-ジメチルスルファモイル基、N, N-ジエチルスルファモイル基、N, N-ジイソプロピルスルファモイル基、N, N-ジtert-ブチルスルファモイル基、N-エチル-N-メチルスルファモイル基、N-イソプロピル-N-メチルスルファモイル基、N-エチル-N-イソプロピルスルファモイル基等が好ましい。

C₁-C₆アルキルスルフィニル基としては、スルフィニル基に炭素数1ないし6個よりなるアルキル基が置換した基が好ましく、具体的には例えばメチルスルフィニル基、エチルスルフィニル基、プロピルスルフィニル基、イソプロピルスルフィニル基、ブチルスルフィニル基、イソブチルスルフィニル基、sec-ブチルスルフィニル基、tert-ブチルスルフィニル基、ペンチルスルフィニル基、ネオペンチルスルフィニル基、ヘキシルスルフィニル基、イソヘキシルスルフィニル基等が挙げられ、中でも例えばメチルスルフィニル基、エチルスルフィニル基、プロピルスルフィニル基、イソプロピルスルフィニル基、ブチルスルフィニル基、tert-ブチルスルフィニル基等が好ましい。

C₁-C₆アルキルスルホニル基としては、スルホニル基に炭素数1ないし6個よりなるアルキル基が置換した基が好ましく、具体的には例えばメチルスルホニル基、エチルスルホニル基、プロピルスルホニル基、イソプロピルスルホニル基、ブチルスルホニル基、イソブチルスルホニル基、sec-ブチルスルホニル基、tert-ブチルスルホニル基、ペンチルスルホニル基、ネオペンチルスルホニル基、ヘキシルスルホニル基、イソヘキシルスルホニル基等が挙げられ、中でも例えばメチルスルホニル基、エチルスルホニル基、プロピルスルホニル基、ブチルスルホニル基、tert-ブチルスルホニル基等が好ましい。

N-C₁-C₆アルキルスルホニルアミノ基としては、アミノ基に炭素数1ないし6個よりなるアルキルスルホニル基がN-置換した基が好ましく、具体的には

- 例えばN-メチルスルホニルアミノ基、N-エチルスルホニルアミノ基、N-プロピルスルホニルアミノ基、N-イソプロピルスルホニルアミノ基、N-ブチルスルホニルアミノ基、N-イソブチルスルホニルアミノ基、N-sec-ブチルスルホニルアミノ基、N-tert-ブチルスルホニルアミノ基、N-ペンチルスルホニルアミノ基、N-ネオペンチルスルホニルアミノ基、N-ヘキシルスルホニルアミノ基、N-イソヘキシルスルホニルアミノ基等が挙げられ、中でも例えばN-メチルスルホニルアミノ基、N-エチルスルホニルアミノ基、N-プロピルスルホニルアミノ基、N-ブチルスルホニルアミノ基、N-tert-ブチルスルホニルアミノ基等が好ましい。
- 10 C₁-C₆アルキルチオ基としては、硫黄原子に炭素数1ないし6個よりなるアルキル基が置換した基が好ましく、具体的には例えばメチルチオ基、エチルチオ基、プロピルチオ基、イソプロピルチオ基、ブチルチオ基、イソブチルチオ基、sec-ブチルチオ基、tert-ブチルチオ基、ペンチルチオ基、ネオペンチルチオ基、ヘキシルチオ基、イソヘキシルチオ基等が挙げられ、中でも例えばメチルチオ基、エチルチオ基、プロピルチオ基、イソプロピルチオ基、ブチルチオ基、tert-ブチルチオ基等が好ましい。
- 15 C₁-C₆アルコキシ基としては、酸素原子に炭素数1ないし6個よりなるアルキル基が置換した基が好ましく、具体的には例えばメトキシ基、エトキシ基、プロポキシ基、イソプロポキシ基、ブトキシ基、イソブトキシ基、sec-ブトキシ基、tert-ブトキシ基、ペンチルオキシ基、ネオペンチルオキシ基、ヘキシルオキシ基、イソヘキシルオキシ基等が挙げられ、中でも例えばメトキシ基、エトキシ基、プロポキシ基、イソプロポキシ基、ブトキシ基、イソブトキシ基、tert-ブトキシ基等が好ましい。
- 20 C₁-C₆アルコキカルボニル基としては、カルボニル基に炭素数1ないし5個よりなるアルコキシ基が置換した基が好ましく、具体的には例えばメトキカルボニル基、エトキカルボニル基、プロポキカルボニル基、イソプロポキカルボニル基、ブトキカルボニル基、イソブトキカルボニル基、sec-ブトキカルボニル基、tert-ブトキカルボニル基、ペンチルオキカルボニル基、ネオペンチルオキカルボニル基等が挙げられ、中でも例えばメトキ

カルボニル基、エトキシカルボニル基、プロポキシカルボニル基、イソプロポキシカルボニル基、ブトキシカルボニル基、tert-ブトキシカルボニル基等が好ましい。

N-C₃-C₆シクロアルキルアミノ基としては、アミノ基に炭素数3ないし6個なる環状のアルキル基がN-置換した基が好ましく、例えばN-シクロプロピルアミノ基、N-シクロブチルアミノ基、N-シクロペンチルアミノ基、N-シクロヘキシルアミノ基等が挙げられ、中でも例えばN-シクロプロピルアミノ基、N-シクロペンチルアミノ基、N-シクロヘキシルアミノ基等が好ましい。

N, N-ジ-C₃-C₆シクロアルキルアミノ基としては、アミノ基に炭素数3ないし6個なる環状のアルキル基がN, N-二置換した基が好ましく、具体的には例えばN, N-ジシクロプロピルアミノ基、N, N-ジシクロブチルアミノ基、N, N-ジシクロペンチルアミノ基、N, N-ジシクロヘキシルアミノ基、N-シクロブチル-N-シクロプロピルアミノ基、N-シクロペンチル-N-シクロプロピルアミノ基等が挙げられ、中でも例えばN, N-ジシクロプロピルアミノ基、N, N-ジシクロブチルアミノ基、N, N-ジシクロペンチルアミノ基等が好ましい。

C₃-C₆シクロアルキルオキシ基としては、酸素原子に炭素数3ないし6個なる環状のアルキル基が置換した基が好ましく、例えばN-シクロプロポキシ基、N-シクロブトキシ基、N-シクロペンチルオキシ基、N-シクロヘキシルオキシ基等が挙げられ、中でも例えばN-シクロプロポキシ基、N-シクロペンチルオキシ基、N-シクロヘキシルオキシ基等が好ましい。

N-C₃-C₆シクロアルキルカルバモイル基としては、カルバモイル基に炭素数3ないし6個なる環状のアルキル基がN-置換した基が好ましく、例えばN-シクロプロピルカルバモイル基、N-シクロブチルカルバモイル基、N-シクロペンチルカルバモイル基、N-シクロヘキシルカルバモイル基等が挙げられ、中でも例えばN-シクロプロピルカルバモイル基、N-シクロペンチルカルバモイル基、N-シクロヘキシルカルバモイル基等が好ましい。

N, N-ジ-C₃-C₆シクロアルキルカルバモイル基としては、カルバモイル基に炭素数3ないし6個なる環状のアルキル基がN, N-二置換した基が好まし

く、具体的には例えばN, N-ジシクロプロピルカルバモイル基、N, N-ジシクロブチルカルバモイル基、N, N-ジシクロペンチルカルバモイル基、N, N-ジシクロヘキシルカルバモイル基、N-シクロブチル-N-シクロプロピルカルバモイル基、N-シクロペンチル-N-シクロプロピルカルバモイル基等が挙げられ、中でも例えば
5 N, N-ジシクロプロピルカルバモイル基、N, N-ジシクロブチルカルバモイル基、N, N-ジシクロペンチルカルバモイル基等が好ましい。

飽和C₁-C₉脂肪族基とは、炭素数1ないし9個よりなるアルキル基が好ましく、直鎖状であっても、分枝状であってもよい。中でも炭素数1ないし6個なる
10 直鎖状又は分枝状のアルキル基が好適である。

該アルキル基としては、例えばメチル基、エチル基、プロピル基、イソプロピル基、ブチル基、イソブチル基、sec-ブチル基、tert-ブチル基、ペンチル基、ネオペンチル基、ヘキシル基、イソヘキシル基、ヘプチル基、オクチル基、ノニル基等が挙げられ、中でも例えばメチル基、エチル基、プロピル基、イソプロピル基、イソブチル基、sec-ブチル基、tert-ブチル基等が好ましい。
15

不飽和のC₁-C₉脂肪族基とは、炭素数1ないし9個よりなるアルケニル基又はアルキニル基が好ましく、直鎖状であっても、分枝状であってもよい。中でも炭素数1ないし6個なる直鎖状又は分枝状のアルケニル基又はアルキニル基が好適である。
20

該アルケニル基としては、例えばビニル基、アリル基、1-プロペニル基、イソプロペニル基、2-ブテニル基、イソブテニル基、2-ペンテニル基、2-ヘキセニル基、2-ヘプテニル基、2-オクテニル基等が挙げられ、中でも例えばビニル基、アリル基、1-プロペニル基等が好ましい。

該アルキニル基としては、例えばエチニル基、1-プロピニル基、1-ブテニル基、1-ペンテニル基、1-ヘキシニル基、1-ヘプチニル基、1-オクチニル基等が挙げられ、中でも例えばエチニル基、1-プロピニル基等が好ましい。
25

5若しくは6員の飽和の炭素環基とは、例えばシクロペンチル基又はシクロヘキシル基等が挙げられ、中でも例えばシクロペンチル基等が好ましい。

- 5 若しくは6員の不飽和の炭素環基とは、例えばシクロペンテニル基又はシクロヘキセニル基等が挙げられ、中でも例えばシクロペンテニル基等が好ましい。
- 5 若しくは6員のヘテロ環基が置換した、N-C₁-C₁₀アルキルカルバモイル基、N-C₁-C₁₀アルキルチオカルバモイル基、チオカルボニル基又はカルボニル基とは、上記の該ヘテロ環基が置換した、N-C₁-C₁₀アルキルカルバモイル基、N-C₁-C₁₀アルキルチオカルバモイル基、チオカルボニル基又はカルボニル基が好ましく、具体的には例えばN-イソオキサゾリルメチルカルバモイル基等のN-イソオキサゾリルアルキルカルバモイル基、N-イソチアゾリルメチルカルバモイル基等のN-イソチアゾリルアルキルカルバモイル基、N-10
イミダゾリルメチルカルバモイル基等のN-イミダゾリルアルキルカルバモイル基、N-オキサゾリルメチルカルバモイル基等のN-オキサゾリルアルキルカルバモイル基、N-オキサジアゾリルメチルカルバモイル基等のN-オキサジアゾリルアルキルカルバモイル基、N-チアゾリルメチルカルバモイル基等のN-チアゾリルアルキルカルバモイル基、N-チアジアゾリルメチルカルバモイル基等のN-チアジアゾリルアルキルカルバモイル基、N-チエニルメチルカルバモイル基等のN-チエニルアルキルカルバモイル基、N-トリアジニルメチルカルバモイル基等のN-トリアジニルアルキルカルバモイル基、N-トリアゾリルメチルカルバモイル基等のN-トリアゾリルアルキルカルバモイル基、N-ピリジルメチルカルバモイル基等のN-ピリジルアルキルカルバモイル基、N-ピラジニルメチルカルバモイル基等のN-ピラジニルアルキルカルバモイル基、N-ピリダジニルメチルカルバモイル基等のN-ピリダジニルアルキルカルバモイル基、N-ピラゾリルメチルカルバモイル基等のN-ピラゾリルアルキルカルバモイル基、N-ピロリルメチルカルバモイル基等のN-ピロリルアルキルカルバモイル基、N-ピラニルメチルカルバモイル基等のN-ピラニルアルキルカルバモイル基、N-フリルメチルカルバモイル基等のN-フリルアルキルカルバモイル基、N-フラザニルメチルカルバモイル基等のN-フラザニルアルキルカルバモイル基、N-イミダゾリジニルメチルカルバモイル基等のN-イミダゾリジニルアルキルカルバモイル基、N-イミダゾリニルメチルカルバモイル基等の

カルバモイル基、N-ピラニルメチルチオカルバモイル基等のN-ピラニルアルキルチオカルバモイル基、N-フリルメチルチオカルバモイル基等のN-フリルアルキルチオカルバモイル基、N-フラザニルメチルチオカルバモイル基等のN-フラザニルアルキルチオカルバモイル基、N-イミダゾリジニルメチルチオカルバモイル基等のN-イミダゾリジニルアルキルチオカルバモイル基、N-イミダゾリニルメチルチオカルバモイル基等のN-イミダゾリニルアルキルチオカルバモイル基、N-テトラヒドロフラニルメチルチオカルバモイル基等のN-テトラヒドロフラニルアルキルチオカルバモイル基、N-ピラゾリジニルメチルチオカルバモイル基等のN-ピラゾリジニルアルキルチオカルバモイル基、N-ピラゾリニルメチルチオカルバモイル基等のN-ピラゾリニルアルキルチオカルバモイル基、N-ピペラジニルメチルチオカルバモイル基等のN-ピペラジニルアルキルチオカルバモイル基、N-ピペリジニルメチルチオカルバモイル基等のN-ピペリジニルアルキルチオカルバモイル基、N-ピロリジニルメチルチオカルバモイル基等のN-ピロリジニルアルキルチオカルバモイル基、N-ピロリニルメチルチオカルバモイル基等のN-ピロリニルアルキルチオカルバモイル基、N-モルホリノメチルチオカルバモイル基等のN-モルホリノアルキルチオカルバモイル基等；例えばイソオキサゾリルチオカルボニル基、イソチアゾリルチオカルボニル基、イミダゾリルチオカルボニル基、オキサゾリルチオカルボニル基、オキサジアゾリルチオカルボニル基、チアゾリルチオカルボニル基、チアジアゾリルチオカルボニル基、チエニルチオカルボニル基、トリアジニルチオカルボニル基、トリアゾリルチオカルボニル基、ピリジルチオカルボニル基、ピラジニルチオカルボニル基、ピラゾリルチオカルボニル基、ピロリルチオカルボニル基、ピラニルチオカルボニル基、フリルチオカルボニル基、フラザニルチオカルボニル基、イミダゾリジニルチオカルボニル基、イミダゾリニルチオカルボニル基、テトラヒドロフラニルチオカルボニル基、ピラゾリジニルチオカルボニル基、ピラゾリニルチオカルボニル基、ピペラジニルチオカルボニル基、ピペリジニルチオカルボニル基、ピロリジニルチオカルボニル基、ピロリニルチオカルボニル基、モルホリノチオカルボニル基等；例えばイソオキサゾリルカルボニル基、イソチアゾリルカ

- ルボニル基、イミダゾリルカルボニル基、オキサゾリルカルボニル基、オキサジ
アゾリルカルボニル基、チアゾリルカルボニル基、チアジアゾリルカルボニル基、
チエニルカルボニル基、トリアジニルカルボニル基、トリアゾリルカルボニル基、
ピリジルカルボニル基、ピラジルカルボニル基、ピラジニルカルボニル基、ピリ
5 ミジニルカルボニル基、ピリダジニルカルボニル基、ピラゾリルカルボニル基、
ピロリルカルボニル基、ピラニルカルボニル基、フリルカルボニル基、フラザニ
ルカルボニル基、イミダゾリジニルカルボニル基、イミダゾリニルカルボニル基、
テトラヒドロフラニルカルボニル基、ピラゾリジニルカルボニル基、ピラゾリニ
ルカルボニル基、ピペラジニルカルボニル基、ピペリジニルカルボニル基、ピロ
10 リジニルカルボニル基、ピロリニルカルボニル基、モルホリノカルボニル基等が
挙げられ、中でも例えばチエニル基、ピリジル基、ピラジニル基、ピリミジニル
基、フリル基、テトラヒドロフラニル基、モルホリノ基等が置換した、N—C₁—
C₁₀アルキルカルバモイル基、N—C₁—C₁₀アルキルチオカルバモイル基、チ
オカルボニル基又はカルボニル基等が好ましい。
- 15 窒素原子、酸素原子及び硫黄原子からなる群より選ばれるヘテロ原子を1環系
当たり1ないし5個有する1ないし3環性の複素芳香環基（5又は6員のヘテロ
環基を除く。）が置換した、N—C₁—C₁₀アルキルカルバモイル基、N—C₁—
C₁₀アルキルチオカルバモイル基、チオカルボニル基又はカルボニル基とは、上
記の該複素芳香環基が置換した、N—C₁—C₁₀アルキルカルバモイル基、N—
20 C₁—C₁₀アルキルチオカルバモイル基、チオカルボニル基又はカルボニル基を
意味し、具体的には例えばN—アクリジニルメチルカルバモイル基等のN—アクリ
ジニルアルキルカルバモイル基、N—イソキノリルメチルカルバモイル基等の
N—イソキノリルアルキルカルバモイル基、N—イソインドリルメチルカルバモ
イル基等のN—イソインドリルアルキルカルバモイル基、N—インダゾリルメチ
25 ルカルバモイル基等のN—インダゾリルアルキルカルバモイル基、N—インドリ
ルメチルカルバモイル基等のN—インドリルアルキルカルバモイル基、N—イン
ドリジニルメチルカルバモイル基等のN—インドリジニルアルキルカルバモイル
基、N—エチレンジオキシフェニルメチルカルバモイル基等のN—エチレンジオ
キシフェニルアルキルカルバモイル基、N—カルバゾリルメチルカルバモイル基

等のN-カルバゾリルアルキルカルバモイル基、N-キナゾリニルメチルカルバモイル基等のN-キナゾリニルアルキルカルバモイル基、N-キノキサリニルメチルカルバモイル基等のN-キノキサリニルアルキルカルバモイル基、N-キノリジニルメチルカルバモイル基等のN-キノリジニルアルキルカルバモイル基、
5 N-キノリルメチルカルバモイル基等のN-キノリルアルキルカルバモイル基、N-クマロニルメチルカルバモイル基等のN-クマロニルアルキルカルバモイル基、N-クロメニルメチルカルバモイル基等のN-クロメニルアルキルカルバモイル基、N-フェナンスリジニルメチルカルバモイル基等のN-フェナンスリジニルアルキルカルバモイル基、N-フェナンスロリニルメチルカルバモイル基等
10 のN-フェナンスロリニルアルキルカルバモイル基、N-ジベンゾフラニルメチルカルバモイル基等のN-ジベンゾフラニルアルキルカルバモイル基、N-ジベンゾチオフェニルメチルカルバモイル基等のN-ジベンゾチオフェニルアルキルカルバモイル基、N-シンノリニルメチルカルバモイル基等のN-シンノリニルアルキルカルバモイル基、N-チオナフテニルメチルカルバモイル基等のN-チ
15 オナフテニルアルキルカルバモイル基、N-ナフチリジニルメチルカルバモイル基等のN-ナフチリジニルアルキルカルバモイル基、N-フェナジニルメチルカルバモイル基等のN-フェナジニルアルキルカルバモイル基、N-フェナキサジニルメチルカルバモイル基等のN-フェナキサジニルアルキルカルバモイル基、N-フェノチアジニルメチルカルバモイル基等のN-フェノチアジニルアルキ
20 カルバモイル基、N-フタラジルメチルカルバモイル基等のN-フタラジルアルキルカルバモイル基、N-ブテリジニルメチルカルバモイル基等のN-ブテリジニルアルキルカルバモイル基、N-ブリニルアルキルカルバモイル基、N-ベンゾイミダゾリルメチルカルバモイル基等のN-ベンゾイミダゾリルアルキルカルバモイル基、N-ベンゾオキサゾリルメ
25 チルカルバモイル基等のN-ベンゾオキサゾリルアルキルカルバモイル基、N-ベンゾチアゾリルメチルカルバモイル基等のN-ベンゾチアゾリルアルキルカルバモイル基、N-ベンゾトリアゾリルメチルカルバモイル基等のN-ベンゾトリアゾリルアルキルカルバモイル基、N-ベンゾフラニルメチルカルバモイル基等のN-ベンゾフラニルアルキルカルバモイル基、N-メチレンジオキシフェニル

- メチルカルバモイル基のN-メチレンジオキシフェニルアルキルカルバモイル基等；N-アクリジニルメチルチオカルバモイル基等のN-アクリジニルアルキルチオカルバモイル基、N-イソキノリルメチルチオカルバモイル基等のN-イソキノリルアルキルチオカルバモイル基、N-イソインドリルメチルチオカルバモイル基等のN-イソインドリルアルキルチオカルバモイル基、N-インダゾリルメチルチオカルバモイル基等のN-インダゾリルアルキルチオカルバモイル基、
5 N-インドリルメチルチオカルバモイル基等のN-インドリルアルキルチオカルバモイル基、N-インドリジニルメチルチオカルバモイル基等のN-インドリジニルアルキルチオカルバモイル基、N-エチレンジオキシフェニルメチルチオカルバモイル基等のN-エチレンジオキシフェニルアルキルチオカルバモイル基、
10 N-カルバゾリルメチルチオカルバモイル基等のN-カルバゾリルアルキルチオカルバモイル基、N-キナゾリニルメチルチオカルバモイル基等のN-キナゾリニルアルキルチオカルバモイル基、N-キノキサリニルメチルチオカルバモイル基等のN-キノキサリニルアルキルチオカルバモイル基、N-キノリジニルメチ
15 ルチオカルバモイル基等のN-キノリジニルアルキルチオカルバモイル基、N-キノリルメチルチオカルバモイル基等のN-キノリルアルキルチオカルバモイル基、N-クマロニルメチルチオカルバモイル基等のN-クマロニルアルキルチオカルバモイル基、N-クロメニルメチルチオカルバモイル基、N-クロメニルチオカルバモイル基等のN-フェナンスリジニルメチルチオカルバモイル
20 基等のN-フェナンスリジニルアルキルチオカルバモイル基、N-フェナンスロリニルメチルチオカルバモイル基、N-ジベンゾフラニルメチルチオカルバモイル基等のN-ジベンゾフラニルアルキルチオカルバモイル基、N-ジベンゾチオフェニルメチルチオカルバモイル基等のN-ジベンゾチオフェニルアルキルチオカルバモイル基、N-
25 シンノリニルメチルチオカルバモイル基等のN-シンノリニルアルキルチオカルバモイル基、N-チオナフテニルメチルチオカルバモイル基等のN-チオナフテニルアルキルチオカルバモイル基、N-ナフチリジニルメチルチオカルバモイル基等のN-ナフチリジニルアルキルチオカルバモイル基、N-フェナジニルメチルチオカルバモイル基等のN-フェナジニルアルキルチオカルバモイル基、N-

フェナキサジニルメチルチオカルバモイル基等のN-フェナキサジニルアルキルチオカルバモイル基、N-フェノチアジニルメチルチオカルバモイル基等のN-フェノチアジニルアルキルチオカルバモイル基、N-フタラジルメチルチオカルバモイル基等のN-フタラジルアルキルチオカルバモイル基、N-ブテリジニルメチルチオカルバモイル基等のN-ブテリジニルアルキルチオカルバモイル基、
5 N-ブリニルメチルチオカルバモイル基等のN-ブリニルアルキルチオカルバモイル基、N-ベンゾイミダゾリルメチルチオカルバモイル基等のN-ベンゾイミダゾリルアルキルチオカルバモイル基、N-ベンゾオキサゾリルメチルチオカルバモイル基等のN-ベンゾオキサゾリルアルキルチオカルバモイル基、N-ベン
10 ソチアゾリルメチルチオカルバモイル基等のN-ベンゾチアゾリルアルキルチオカルバモイル基、N-ベンゾトリアゾリルメチルチオカルバモイル基等のN-ベ
ンゾトリアゾリルアルキルチオカルバモイル基、N-ベンゾフラニルメチルチオカルバモイル基等のN-ベンゾフラニルアルキルチオカルバモイル基、N-メチ
レンジオキシフェニルメチルチオカルバモイル基のN-メチレンジオキシフェニ
15 ルアルキルチオカルバモイル基等；例えばアクリジニルチオカルボニル基、イソ
キノリルチオカルボニル基、イソインドリルチオカルボニル基、インダゾリルチ
オカルボニル基、インドリルチオカルボニル基、インドリジニルチオカルボニル
基、エチレンジオキシフェニルチオカルボニル基、カルバゾリルチオカルボニル
基、キナゾリニルチオカルボニル基、キノキサリニルチオカルボニル基、キノリ
20 ジニルチオカルボニル基、キノリルチオカルボニル基、クマロニルチオカルボニ
ル基、クロメニルチオカルボニル基、フェナンスリジニルチオカルボニル基、フェ
ナンスロリニルチオカルボニル基、ジベンゾフラニルチオカルボニル基、ジベン
ゾチオフェニルチオカルボニル基、シンノリニルチオカルボニル基、チオナフテ
ニルチオカルボニル基、ナフチリジニルチオカルボニル基、フェナジニルチオカ
25 ルボニル基、フェナキサジニルチオカルボニル基、フェノチアジニルチオカルボ
ニル基、フタラジルチオカルボニル基、ブテリジニルチオカルボニル基、ブリニ
ルチオカルボニル基、ベンゾイミダゾリルチオカルボニル基、ベンゾオキサゾリ
ルチオカルボニル基、ベンゾチアゾリルチオカルボニル基、ベンゾトリアゾリル
チオカルボニル基、ベンゾフラニルチオカルボニル基又はメチレンジオキシフェ

- ニルチオカルボニル基等；例えばアクリジニルカルボニル基、イソキノリルカルボニル基、イソインドリルカルボニル基、インダゾリルカルボニル基、インドリルカルボニル基、インドリジニルカルボニル基、エチレンジオキシフェニルカルボニル基、カルバゾリルカルボニル基、キナゾリニルカルボニル基、キノキサリニルカルボニル基、キノリジニルカルボニル基、キノリルカルボニル基、クマロニルカルボニル基、クロメニルカルボニル基、フェナンスリジニルカルボニル基、フェナンスロリニルカルボニル基、ジベンゾフラニルカルボニル基、ジベンゾチオフェニルカルボニル基、シンノリニルカルボニル基、チオナフテニルカルボニル基、ナフチリジニルカルボニル基、フェナジニルカルボニル基、フェナキサジニルカルボニル基、フェノチアジニルカルボニル基、フタラジルカルボニル基、ブテリジニルカルボニル基、ブリニルカルボニル基、ベンゾイミダゾリルカルボニル基、ベンゾオキサゾリルカルボニル基、ベンゾチアゾリルカルボニル基、ベンゾトリアゾリルカルボニル基、ベンゾフラニルカルボニル基又はメチレンジオキシフェニルカルボニル基等が挙げられ、中でも例えばエチレンジオキシフェニル基、ジベンゾフラニル基、ジベンゾチオフェニル基、メチレンジオキシフェニル基等が置換した、 $N-C_1-C_{10}$ アルキルカルバモイル基、 $N-C_1-C_{10}$ アルキルチオカルバモイル基、チオカルボニル基又はカルボニル基等が好ましい。
- 縮合アリール基とは、例えばフェニル基又はナフチル基が他の環に結合して、縮合ベンゼン環又は縮合ナフタレン環を形成する基をいう。
- 20 2ないし3環性の飽和又は不飽和の C_6-C_{15} 縮合炭素環基としては、具体的には例えばアセナフチレニル基、アダマンチル基、アンスリル基、インダニル基、インデニル基、 C_6-C_8 シクロアルカニル基、 C_6-C_8 シクロアルカジエニル基、 C_6-C_8 シクロアルケニル基、ノルボルニル基、フェナンスリル基、フレオレニル基等が挙げられ、中でも例えばアンスリル基、 C_6-C_8 シクロアルカニル基、 C_6-C_8 シクロアルカジエニル基、 C_6-C_8 シクロアルケニル基等が好適である。
- 該 C_6-C_8 シクロアルカニル基としては、例えばシクロヘキサニル基、シクロヘプタニル基、シクロオクタニル基等が挙げられ、中でも例えばシクロヘキサン基等が好ましい。
- 該 C_6-C_8 シクロアルカジエニル基としては、例えばシクロヘキサジエニル基、

シクロヘプタジエニル基、シクロオクタジエニル基等が挙げられ、中でも例えばシクロヘキサジエニル基等が好ましい。

該C₆—C₈シクロアルケニル基としては、例えばシクロヘキセニル基、シクロヘプテニル基、シクロオクテニル基等が挙げられ、中でも例えばシクロヘキセニル基等が好ましい。

- 6員のヘテロ環基又は窒素原子、酸素原子及び硫黄原子からなる群より選ばれるヘテロ原子を1環系当たり1ないし5個有する2ないし3環性の縮合複素芳香環基としては、例えばイソキノリル基、イソインドリル基、インダゾリル基、インドリル基、インドリジニル基、エチレンジオキシフェニル基、キナゾリニル基、
10 キノキサリニル基、キノリジニル基、キノリル基、クマロニル基、クロメニル基、チオナフテニル基、ナフチリジニル基、ピリジル基、ピラジニル基、ピリミジニル基、ピリダジニル基、ピラニル基、フタラジル基、ベンゾイミダゾリル基、ベンゾオキサゾリル基、ベンゾチアゾリル基、ベンゾトリアゾリル基、ベンゾフラン基又はメチレンジオキシフェニル基等が挙げられ、中でも例えばエチレンジ
15 オキシフェニル基、ピリジル基、ピラジニル基、ピリミジニル基、ピリダジニル基、ベンゾイミダゾリル基、ベンゾオキサゾリル基、ベンゾチアゾリル基、ベンゾトリアゾリル基、ベンゾフラン基又はメチレンジオキシフェニル基等が好適である。特に、例えばエチレンジオキシフェニル基、ピリジル基、ピラジニル基、ピリミジニル基、ピリダジニル又はメチレンジオキシフェニル基等が好適である。
20 Rは、例えばアリール基、1ないし3環性のC₇—C₁₅炭素芳香環基又は5若しくは6員のヘテロ環基若しくは窒素原子、酸素原子及び硫黄原子からなる群より選ばれるヘテロ原子を1環系当たり1ないし5個有する1ないし3環性の複素芳香環基等を示す。

- 具体的には、該アリール基としては、炭素数6ないし15個よりなるアリール基が好ましく、例えばナフチル基、フェニル基等が挙げられ、中でも例えばフェニル基等が好ましい。

該1ないし3環性のC₇—C₁₅炭素芳香環基としては、炭素数7ないし15個を含む1ないし3の環状基を含む芳香環基が好ましく、例えばアセナフチレニル基、アダマンチル基、アンスリル基、インデニル基、ノルボルニル基、フェナン

スリル基等が挙げられ、中でも例えばアンスリル基、フェナ NS リル基等が好ましい。

- 該 5 又は 6 員のヘテロ環基としては、例えばイソオキサゾリル基、イソチアゾリル基、イミダゾリル基、オキサゾリル基、オキサジアゾリル基、チアゾリル基、
 5 チアジアゾリル基、チエニル基、トリアジニル基、トリアゾリル基、ピリジル基、ピラジニル基、ピリミジニル基、ピリダジニル基、ピラゾリル基、ピロリル基、ピラニル基、フリル基、フラザニル基、イミダゾリジニル基、イミダゾリニル基、テトラヒドロフラニル基、ピラゾリジニル基、ピラゾリニル基、ピペラジニル基、
 10 ピペリジニル基、ピロリジニル基、ピロリニル基、モルホリノ基等が挙げられ、中でも例えばチエニル基、テトラヒドロフラニル基、ピリジル基、ピラジニル基、
 ピリミジニル基、フリル基、モルホリノ基等が好ましい。

- 該窒素原子、酸素原子及び硫黄原子からなる群より選ばれるヘテロ原子を 1 環系当たり 1 ないし 5 個有する 1 ないし 3 環性の複素芳香環基としては、例えばアクリジニル基、イソキノリル基、イソインドリル基、インダゾリル基、インドリル基、インドリジニル基、エチレンジオキシフェニル基、カルバゾリル基、キナゾリニル基、キノキサリニル基、キノリジニル基、キノリル基、クマロニル基、クロメニル基、フェナ NS リジニル基、フェナ NS ロリニル基、ジベンゾフラニル基、ジベンゾチオフェニル基、シンノリニル基、チオナフテニル基、ナフチリジニル基、フェナジニル基、フェナキサジニル基、フェノチアジニル基、フタラジニル基、ブテリジニル基、ブリニル基、ベンゾイミダゾリル基、ベンゾオキサゾリル基、ベンゾチアゾリル基、ベンゾトリアゾリル基、ベンゾフラニル基、メチレンジオキシフェニル基等が挙げられ、中でも例えばエチレンジオキシフェニル基、ジベンゾフラニル基、ジベンゾチオフェニル基、メチレンジオキシフェニル基等が好ましい。
 25 Rにおいては、中でも例えばアリール基等が好適であり、特に例えばフェニル基等が好適である。なお、R の各置換基は、1 又はそれ以上の置換基を適宜有することができる。

置換基の具体例としては、例えばアジド基、アミノ基、カルバモイル基、カルバモイルアミノ基、カルバモイルオキシ基、カルボキシル基、シアノ基、スルファ

モイル基、スルホ基、ニトロ基、ハロゲン原子、ヒドロキシ基、ホルミル基、ホルミルアミノ基、環状の飽和C₃—C₉脂肪族基、環状の不飽和C₃—C₉脂肪族基、アラルキル基、N—アラルキルアミノ基、N, N—ジアラルキルアミノ基、アラルキルオキシ基、アラルキルカルボニル基、N—アラルキルカルバモイル基、アリール基、N—アリールアミノ基、N, N—ジアリールアミノ基、アリールオキシ基、アリールスルホニル基、アリールスルホニルオキシ基、N—アリールスルホニルアミノ基、N—アリールスルホニルアミノC₁—C₁₀アルキルアミノ基、N—アリールスルホニルアミノC₁—C₁₀アルキルカルバモイル基、N—アリールスルホニルアミノC₁—C₆アルコキシカルボニル基、アリールスルファモイル基、アリールスルファモイルオキシ基、N—アリールスルファモイルC₁—C₁₀アルキルカルバモイル基、アリールスルファモイルC₁—C₆アルコキシカルボニル基、N—アリールカルバモイル基、アロイル基、アロキシ基、N—(N—アロイルアミノ)C₁—C₁₀アルキルカルバモイル基、N—アロイルアミノC₁—C₁₀アルコキシカルボニル基、C₂—C₆アルカノイル基、N—C₂—C₆アルカノイ

10 ルアミノ基、N, N—ジ—C₂—C₆アルカノイルアミノ基、N—C₁—C₆アルキルアミノ基、N, N—ジ—C₁—C₆アルキルアミノ基、N—C₁—C₁₀アルキルカルバモイル基、N—C₁—C₁₀アルキルカルバモイル基、N, N—ジ—C₁—C₁₀アルキルカルバモイル基、N, N—ジ—C₁—C₁₀アルキルチオカルバモイル基、N—C₂—C₆アルケニルカルバモイル基、N, N—ジ—C₂—C₆アルケニ

15 ルカルバモイル基、N—アミノC₁—C₁₀アルキルカルバモイル基、N—C₁—C₆アルコキシC₁—C₁₀アルキルカルバモイル基、N—C₁—C₆アルコキシカルボニルC₁—C₁₀アルキルカルバモイル基、N—C₁—C₆アルコキシカルボニルアミノC₁—C₁₀アルキルカルバモイル基、N—C₁—C₆アルコキシカルボニルアミノC₁—C₆アルコキシカルボニル基、C₁—C₆アルキルチオ基、N—C₁—C₆

20 アルキルスルファモイル基、N, N—ジ—C₁—C₆アルキルスルファモイル基、C₁—C₆アルキルスルフィニル基、C₁—C₆アルキルスルホニル基、N—C₁—C₆アルキルスルホニルアミノ基、C₁—C₆アルコキシ基、C₁—C₆アルコキシカルボニル基、アミノC₁—C₆アルコキシカルボニル基、N—C₃—C₆シクロアルキルアミノ基、C₃—C₆

25 アルキルスルファモイル基、N, N—ジ—C₁—C₆アルキルスルファモイル基、C₁—C₆アルキルスルフィニル基、C₁—C₆アルキルスルホニルアミノ基、C₁—C₆アルコキシ基、C₁—C₆アルコキシカルボニル基、アミノC₁—C₆アルコキシカルボニル基、N—C₃—C₆シクロアルキルアミノ基、C₃—C₆

シクロアルキルオキシ基、N—C₃—C₆シクロアルキルカルバモイル基及びN、N—ジ—C₃—C₆シクロアルキルカルバモイル基からなる群より選択される置換基、イソオキサゾリル基、イソチアゾリル基、イミダゾリル基、オキサゾリル基、オキサジアゾリル基、チアゾリル基、チアジアゾリル基、チエニル基、トリ

5 アジニル基、トリアゾリル基、ピリジル基、ピラジニル基、ピリミジニル基、ピリダジニル基、ピラゾリル基、ピロリル基、ピラニル基、フリル基、フラザニル基、イミダゾリジニル基、イミダゾリニル基、テトラヒドロフラニル基、ピラゾリジニル基、ピラゾリニル基、ピペラジニル基、ピペリジニル基、ピロリジニル基、ピロリニル基及びモルホリノ基からなる群より選択される5又は6員のヘテ

10 ロ環基、アクリジニル基、イソキノリル基、イソインドリル基、インダゾリル基、インドリル基、インドリジニル基、エチレンジオキシフェニル基、カルバゾリル基、キナゾリニル基、キノキサリニル基、キノリジニル基、キノリル基、クマロニル基、クロメニル基、フェナンスリジニル基、フェナンスロリニル基、ジベンゾフラニル基、ジベンゾチオフェニル基、シンノリニル基、チオナフテニル基、

15 ナフチリジニル基、フェナジニル基、フェナキサジニル基、フェノチアジニル基、フタラジニル基、ブテリジニル基、ブリニル基、ベンゾイミダゾリル基、ベンゾオキサゾリル基、ベンゾチアゾリル基、ベンゾトリアゾリル基、ベンゾフラニル基及びメチレンジオキシフェニル基からなる群より選択される窒素原子、酸素原子及び硫黄原子からなる群より選ばれるヘテロ原子を1環系当たり1ないし5個

20 有する1ないし3環性の複素芳香環基並びに該ヘテロ環基又は該複素芳香環基が置換した、N—C₁—C₁₀アルキルカルバモイル基、N—C₁—C₁₀アルキルチオカルバモイル基、チオカルボニル基並びにカルボニル基からなる群から選択される置換基並びに該置換基で置換されていてもよい、直鎖の飽和C₁—C₉脂肪族基、直鎖の不飽和C₁—C₉脂肪族基、分枝鎖の飽和C₁—C₉脂肪族基、分枝鎖の不飽

25 和のC₁—C₉脂肪族基、C₁—C₆アルコキシ基、C₁—C₆アルキルチオ基及びN—C₁—C₆アルキルアミノ基からなる群より選択される置換基からなる群より選択される置換基を列挙することができる。

Rの置換基の中では、例えばアミノ基、カルバモイル基、カルバモイルアミノ基、カルバモイルオキシ基、カルボキシル基、ニトロ基、ハロゲン原子、ヒドロ

キシ基、環状の飽和C₃—C₉脂肪族基、環状の不飽和C₃—C₉脂肪族基、アラルキル基、N—アラルキルアミノ基、アラルキルオキシ基、アラルキルカルボニル基、N—アラルキルカルバモイル基、アリール基、N—アリールアミノ基、アリールオキシ基、アリールスルホニル基、アリールスルホニルオキシ基、N—アリールスルホニルアミノ基、N—アリールスルホニルアミノC₁—C₁₀アルキルアミノ基、N—アリールスルホニルアミノC₁—C₁₀アルキルカルバモイル基、N—アリールスルホニルアミノC₁—C₆アルコキシカルボニル基、アリールスルファモイル基、アリールスルファモイルオキシ基、N—アリールスルファモイルC₁—C₁₀アルキルカルバモイル基、アリールスルファモイルC₁—C₆アルコキシカルボニル基、N—アリールカルバモイル基、アロイル基、アロキシ基、N—(N—アロイルアミノ)C₁—C₁₀アルキルカルバモイル基、N—アロイルアミノC₁—C₁₀アルコキシカルボニル基、C₂—C₆アルカノイル基、N—C₂—C₆アルカノイルアミノ基、N—C₁—C₆アルキルアミノ基、N—N—ジ—C₁—C₆アルキルアミノ基、N—C₁—C₁₀アルキルカルバモイル基、N—C₁—C₁₀アルキルチオカルバモイル基、N—N—ジ—C₁—C₁₀アルキルカルバモイル基、N—N—ジ—C₂—C₆アルケニルカルバモイル基、N—アミノC₁—C₁₀アルキルカルバモイル基、N—N—ジ—C₂—C₆アルケニルカルバモイル基、N—C₁—C₆アルコキシカルボニルC₁—C₁₀アルキルカルバモイル基、N—C₁—C₆アルコキシカルボニルアミノC₁—C₁₀アルキルカルバモイル基、N—C₁—C₆アルコキシカルボニルアミノC₁—C₆アルコキシカルボニル基、C₁—C₆アルキルチオ基、C₁—C₆アルキルスルフィニル基、C₁—C₆アルキルスルホニル基、N—C₁—C₆アルキルスルホニルアミノ基、C₁—C₆アルコキシ基、C₁—C₆アルコキシカルボニル基、アミノC₁—C₆アルコキシカルボニル基、N—C₃—C₆シクロアルキルアミノ基、N—N—ジ—C₃—C₆シクロアルキルアミノ基、C₃—C₆シクロアルキルオキシ基、N—C₃—C₆シクロアルキルカルバモイル基及びN—N—ジ—C₃—C₆シクロアルキルカルバモイル基からなる群より選択される置換基、イソオキサゾリル基、イソチアゾリル基、イミダゾリル基、オキサゾリル基、オキサジアゾリル基、チアゾリル基、チアジアゾリル基、

チエニル基、トリアゾリル基、ピリジル基、ピラジニル基、ピリミジニル基、ピリダジニル基、ピラゾリル基、ピロリル基、ピラニル基、フリル基、イミダゾリジニル基、イミダゾリニル基、テトラヒドロフラニル基、ピラゾリジニル基、ピラゾリニル基、ピペラジニル基、ピペリジニル基、ピロリジニル基、ピロリニル基及びモルホリノ基からなる群より選択される5又は6員のヘテロ環基、イソキノリル基、イソインドリル基、インダゾリル基、インドリル基、エチレンジオキシフェニル基、カルバゾリル基、キナゾリニル基、キノキサリニル基、キノリジニル基、キノリル基、クマロニル基、クロメニル基、フェナンスリジニル基、フェナンスロリニル基、ジベンゾフラニル基、ジベンゾチオフェニル基、シンノリニル基、チオナフテニル基、ナフチリジニル基、フェナジニル基、フェナキサジニル基、ベンゾイミダゾリル基、ベンゾオキサゾリル基、ベンゾチアゾリル基、ベンゾトリアゾリル基、ベンゾフラニル基及びメチレンジオキシフェニル基からなる群より選択される窒素原子、酸素原子及び硫黄原子からなる群より選ばれるヘテロ原子を1環系当たり1ないし5個有する1ないし3環性の複素芳香環基並びに該ヘテロ環基又は該複素芳香環基が置換した、 $N-C_1-C_{10}$ アルキルカルバモイル基、 $N-C_1-C_{10}$ アルキルチオカルバモイル基、チオカルボニル基並びにカルボニル基からなる群から選択される置換基並びに該置換基で置換されてもよい、直鎖の飽和 C_1-C_9 脂肪族基、直鎖の不飽和 C_1-C_9 脂肪族基、分枝鎖の飽和 C_1-C_9 脂肪族基、分枝鎖の不飽和の C_1-C_9 脂肪族基、 C_1-C_6 アルコキシ基及び C_1-C_6 アルキルチオ基からなる群より選択される置換基からなる群より選択される置換基等が好ましく、特に例えばアミノ基、カルバモイル基、カルボキシル基、ニトロ基、ハロゲン原子、ヒドロキシ基、アラルキルカルボニル基、 N -アラルキルカルバモイル基、アリール基、アロイル基、 C_2-C_6 アルカノイル基、 $N-C_1-C_6$ アルキルアミノ基、 $N-C_1-C_{10}$ アルキルカルバモイル基、 $N-C_1-C_{10}$ アルキルチオカルバモイル基、 $N-N-C_1-C_{10}$ アルキルカルバモイル基、 $N-N-C_1-C_{10}$ アルキルチオカルバモイル基、 $N-N-C_2-C_6$ アルケニルカルバモイル基、 $N-N-C_2-C_6$ アルケニルカルバモイル基、 $N-N-C_1-C_{10}$ アルキルカルバモイル基、 $N-N-C_1-C_6$ アルコキシカルボニル基、 $N-N-C_1-C_6$ アルキルカルバモイル基、 $N-N-C_1-C_6$ アルコキシカルボニル基。

$C_1 - C_{10}$ アルキルカルバモイル基、 $C_1 - C_6$ アルコキシ基、アミノ $C_1 - C_6$ アルコキシカルボニル基、 $N - C_3 - C_6$ シクロアルキルアミノ基、 N, N -ジ- $C_3 - C_6$ シクロアルキルアミノ基、 $C_3 - C_6$ シクロアルキルオキシ基、 $N - C_3 - C_6$ シクロアルキルカルバモイル基及び N, N -ジ- $C_3 - C_6$ シクロアルキルカルバモイル基からなる群より選択される置換基、チエニル基、ピリジル基、ピラジニル基、ピリミジニル基、フリル基、テトラヒドロフラニル基及びモルホリノ基からなる群より選択される5又は6員のヘテロ環基、エチレンジオキシフェニル基、ジベンゾフラニル基、ジベンゾチオフェニル基及びメチレンジオキシフェニル基からなる群より選択される窒素原子、酸素原子及び硫黄原子からなる群より選ばれるヘテロ原子を1環系当たり1ないし5個有する1ないし3環性の複素芳香環基並びに該ヘテロ環基又は該複素芳香環基が置換した、 $N - C_1 - C_{10}$ アルキルカルバモイル基、 $N - C_1 - C_{10}$ アルキルチオカルバモイル基、チオカルボニル基並びにカルボニル基からなる群から選択される置換基並びに該置換基で置換されていてもよい、直鎖の飽和 $C_1 - C_9$ 脂肪族基、直鎖の不飽和 $C_1 - C_9$ 脂肪族基、分枝鎖の飽和 $C_1 - C_9$ 脂肪族基、分枝鎖の不飽和の $C_1 - C_9$ 脂肪族基及び $C_1 - C_6$ アルコキシ基からなる群より選択される置換基からなる群より選択される置換基等が好適である。

即ち、例えばアミノ基、カルバモイル基、カルバモイルアミノ基、カルバモイルオキシ基、カルボキシリ基、ニトロ基、ハロゲン原子、ヒドロキシ基、環状の飽和 $C_3 - C_9$ 脂肪族基、環状の不飽和 $C_3 - C_9$ 脂肪族基、アラルキル基、 N -アラルキルアミノ基、アラルキルオキシ基、アラルキルカルボニル基、 N -アラルキルカルバモイル基、アリール基、 N -アリールアミノ基、アリールオキシ基、アリールスルホニル基、アリールスルホニルオキシ基、 N -アリールスルホニルアミノ基、 N -アリールスルホニルアミノ $C_1 - C_{10}$ アルキルアミノ基、 N -アリールスルホニルアミノ $C_1 - C_6$ アルコキシカルボニル基、アリールスルファモイル基、アリールスルファモイルオキシ基、 N -アリールスルファモイル $C_1 - C_{10}$ アルキルカルバモイル基、アリールスルファモイル $C_1 - C_6$ アルコキシカルボニル基、 N -アリールカルバモイル基、アロイル基、アロキシ基、 $N - (N$ -アロイルア

ミノ) C_1-C_{10} アルキルカルバモイル基、N-アロイルアミノ C_1-C_{10} アルコキシカルボニル基、 C_2-C_6 アルカノイル基、N- C_2-C_6 アルカノイルアミノ基、N- C_1-C_6 アルキルアミノ基、N, N-ジ- C_1-C_6 アルキルアミノ基、N- C_1-C_{10} アルキルカルバモイル基、N- C_1-C_{10} アルキルチオカルバモイル基、N, N-ジ- C_1-C_{10} アルキルカルバモイル基、N, N-ジ- C_1-C_1 ₀アルキルチオカルバモイル基、N- C_2-C_6 アルケニルカルバモイル基、N, N-ジ- C_2-C_6 アルケニルカルバモイル基、N-アミノ C_1-C_{10} アルキルカルバモイル基、N- C_1-C_6 アルコキシカルボニル C_1-C_{10} アルキルカルバモイル基、N- C_1-C_6 アルコキシカルボニルアミノ C_1-C_{10} アルキルカルバモイル基、N- C_1-C_6 アルコキシカルボニルアミノ C_1-C_6 アルコキシカルボニル基、 C_1-C_6 アルキルチオ基、 C_1-C_6 アルキルスルフィニル基、 C_1-C_6 アルキルスルホニル基、N- C_1-C_6 アルキルスルホニルアミノ基、 C_1-C_6 アルコキシ基、 C_1-C_6 アルコキシカルボニル基、アミノ C_1-C_6 アルコキシカルボニル基、N- C_3-C_6 シクロアルキルアミノ基、N, N-ジ- C_3-C_6 シクロアルキルアミノ基、 C_3-C_6 シクロアルキルオキシ基、N- C_3-C_6 シクロアルキルカルバモイル基及びN, N-ジ- C_3-C_6 シクロアルキルカルバモイル基からなる群より選択される置換基、イソオキサゾリル基、イソチアゾリル基、イミダゾリル基、オキサゾリル基、オキサジアゾリル基、チアゾリル基、チアジアゾリル基、チエニル基、トリアゾリル基、ピリジル基、ピラジニル基、ピリミジニル基、ピリダジニル基、ピラゾリル基、ピロリル基、ピラニル基、フリル基、イミダゾリジニル基、イミダゾリニル基、テトラヒドロフラニル基、ピラゾリジニル基、ピラゾリニル基、ピペラジニル基、ピペリジニル基、ピロリジニル基、ピロリニル基及びモルホリノ基からなる群より選択される5又は6員のヘテロ環基、イソキノリル基、イソインドリル基、インダゾリル基、インドリル基、エチレンジオキシフェニル基、カルバゾリル基、キナゾリニル基、キノキサリニル基、キノリジニル基、キノリル基、クマロニル基、クロメニル基、フェナンスリジニル基、フェナンスロリニル基、ジベンゾフラニル基、ジベンゾチオフェニル基、シンノリニル基、チオナフテニル基、ナフチリジニル基、フェナジニル基、フェナキサジニル基、ベンゾ

イミダゾリル基、ベンゾオキサゾリル基、ベンゾチアゾリル基、ベンゾトリアゾリル基、ベンゾフラニル基及びメチレンジオキシフェニル基からなる群より選択される窒素原子、酸素原子及び硫黄原子からなる群より選ばれるヘテロ原子を1環系当たり1ないし5個有する1ないし3環性の複素芳香環基並びに該ヘテロ環基又は該複素芳香環基が置換した、N—C₁—C₁₀アルキルカルバモイル基、N—C₁—C₁₀アルキルチオカルバモイル基、チオカルボニル基並びにカルボニル基からなる群から選択される置換基並びに該置換基で置換されていてもよい、直鎖の飽和C₁—C₉脂肪族基、直鎖の不飽和C₁—C₉脂肪族基、分枝鎖の飽和C₁—C₉脂肪族基、分枝鎖の不飽和のC₁—C₉脂肪族基、C₁—C₆アルコキシ基及びC₁—C₆アルキルチオ基からなる群より選択される置換基からなる群より選択される置換基を1又はそれ以上有していてもよい、アリール基、アダマンチル基、アンスリル基、インデニル基、ノルボルニル基及びフェナンスリル基からなる群より選択される1ないし3環性のC₇—C₁₅炭素芳香環基又はイソオキサゾリル基、イソチアゾリル基、イミダゾリル基、オキサゾリル基、オキサジアゾリル基、15チアゾリル基、チアジアゾリル基、チエニル基、トリアゾリル基、ピリジル基、ピラジニル基、ピリミジニル基、ピリダジニル基、ピラゾリル基、ピロリル基、ピラニル基、フリル基、イミダゾリジニル基、イミダゾリニル基、テトラヒドロフラニル基、ピラゾリジニル基、ピラゾリニル基、ピペラジニル基、ピペリジニル基、ピロリジニル基、ピロリニル基及びモルホリノ基からなる群より選択される5又は6員のヘテロ環基若しくはイソキノリル基、イソインドリル基、インダゾリル基、インドリル基、エチレンジオキシフェニル基、カルバゾリル基、キナゾリニル基、キノキサリニル基、キノリジニル基、キノリル基、クマロニル基、クロメニル基、フェナンスリジニル基、フェナンスロリニル基、ジベンゾフラニル基、ジベンゾチオフェニル基、シンノリニル基、チオナフテニル基、ナフチリジニル基、フェナジニル基、フェナキサジニル基、ベンゾイミダゾリル基、ベンゾオキサゾリル基、ベンゾチアゾリル基、ベンゾトリアゾリル基、ベンゾフラニル基及びメチレンジオキシフェニル基からなる群より選択される窒素原子、酸素原子及び硫黄原子からなる群より選ばれるヘテロ原子を1環系当たり1ないし5個有する1ないし3環性の複素芳香環基等（R^a）が好適な基であり、特に例え

ばアミノ基、カルバモイル基、カルボキシル基、ニトロ基、ハロゲン原子、ヒドロキシ基、アラルキルカルボニル基、N-アラルキルカルバモイル基、アリール基、アロイル基、C₂-C₆アルカノイル基、N-C₁-C₆アルキルアミノ基、N-C₁-C₁₀アルキルカルバモイル基、N-C₁-C₁₀アルキルチオカルバモイル基、

5 N, N-ジ-C₁-C₁₀アルキルカルバモイル基、N, N-ジ-C₁-C₁₀アルキルチオカルバモイル基、N-C₂-C₆アルケニルカルバモイル基、N, N-ジ-C₂-C₆アルケニルカルバモイル基、N-アミノC₁-C₁₀アルキルカルバモイル基、N-C₁-C₆アルコキシC₁-C₁₀アルキルカルバモイル基、N-C₁-C₆アルコキシカルボニルC₁-C₁₀アルキルカルバモイル基、C₁-C₆アルコキシ基、アミノC₁-C₆アルコキシカルボニル基、N-C₃-C₆シクロアルキルアミノ基、N, N-ジ-C₃-C₆シクロアルキルアミノ基、C₃-C₆シクロアルキルオキシ基、N-C₃-C₆シクロアルキルカルバモイル基及びN, N-ジ-C₃-C₆シクロアルキルカルバモイル基からなる群より選択される置換基、チエニル基、ピリジル基、ピラジニル基、ピリミジニル基、フリル基、テトラヒドロフ

10 ラニル基及びモルホリノ基からなる群より選択される5又は6員のヘテロ環基、エチレンジオキシフェニル基、ジベンゾフラニル基、ジベンゾチオフェニル基及びメチレンジオキシフェニル基からなる群より選択される窒素原子、酸素原子及び硫黄原子からなる群より選ばれるヘテロ原子を1環系当たり1ないし5個有する1ないし3環性の複素芳香環基並びに該ヘテロ環基又は該複素芳香環基が置換

15 した、N-C₁-C₁₀アルキルカルバモイル基、N-C₁-C₁₀アルキルチオカルバモイル基、チオカルボニル基並びにカルボニル基からなる群から選択される置換基並びに該置換基で置換されていてもよい、直鎖の飽和C₁-C₉脂肪族基、直鎖の不飽和C₁-C₉脂肪族基、分枝鎖の飽和C₁-C₉脂肪族基、分枝鎖の不飽和のC₁-C₉脂肪族基及びC₁-C₆アルコキシ基からなる群より選択される置換

20 基からなる群より選択される置換基を1又はそれ以上有していてもよい、アリール基、アンスリル基及びフェナンスリル基からなる群より選択される1ないし3環性のC₇-C₁₅炭素芳香環基又はチエニル基、ピリジル基、ピラジニル基、ピリミジニル基、フリル基、テトラヒドロフラニル基及びモルホリノ基からなる群より選択される5又は6員のヘテロ環基若しくはエチレンジオキシフェニル基、

25

ジベンゾフラニル基、ジベンゾチオフェニル基及びメチレンジオキシフェニル基からなる群より選択される窒素原子、酸素原子及び硫黄原子からなる群より選ばれるヘテロ原子を1環系当たり1ないし5個有する1ないし3環性の複素芳香環基等（R^b）がより好適な基である。

- 5 R¹及びR²は、同一又は異なって、例えば水素原子、アジド基、アミノ基、カルバモイル基、カルバモイルアミノ基、カルバモイルオキシ基、カルボキシリ基、シアノ基、スルファモイル基、スルホ基、ニトロ基、ハロゲン原子、ヒドロキシリ基、ホルミル基、ホルミルアミノ基、環状の飽和C₃—C₉脂肪族基、環状の不飽和C₃—C₉脂肪族基、アラルキル基、N—アラルキルアミノ基、アラルキルオキシ基、アラルキルカルボニル基、アリール基、N—アリールアミノ基、アリールオキシ基、アリールスルホニル基、N—アリールスルホニルアミノ基、N—アリールスルホニルアミノC₁—C₁₀アルキルアミノ基、N—アリールスルホニルアミノC₁—C₆アルコキシカルボニル基、C₂—C₆アルカノイル基、N—C₂—C₆アルカノイルアミノ基、アロイル基、N—アロイルアミノ基、N—アロイルC₁—C₁₀アルキルアミノ基、N—アロイルC₁—C₁₀アルキルカルバモイル基、N—C₁—C₆アルキルアミノ基、N，N—ジーC₁—C₆アルキルアミノ基、N—C₁—C₁₀アルキルカルバモイル基、N，N—ジーC₁—C₁₀アルキルカルバモイル基、N—C₁—C₆アルキルスルファモイル基、C₁—C₆アルキルスルフィニル基、C₁—C₆アルキルスルホニル基、N—C₁—C₆アルキルスルホニルアミノ基、C₁—C₆アルキルチオ基、C₁—C₆アルコキシリ基、C₁—C₆アルコキシカルボニル基、N—C₃—C₆シクロアルキルアミノ基、C₃—C₆シクロアルキルオキシ基及びN—C₃—C₆シクロアルキルカルバモイル基からなる群から選択される置換基又は該置換基で置換されていてもよい、直鎖の飽和C₁—C₉脂肪族基、直鎖の不飽和C₁—C₉脂肪族基、分枝鎖の飽和C₁—C₉脂肪族基、分枝鎖の不飽和のC₁—C₉脂肪族基、N—C₁—C₆アルキルアミノ基、C₁—C₆アルキルチオ基若しくはC₁—C₆アルコキシリ基等を示し、中でも例えば水素原子、アミノ基、カルボキシリ基、シアノ基、スルファモイル基、スルホ基、ニトロ基、ハロゲン原子、ヒドロキシリ基、ホルミル基、環状の飽和C₃—C₉脂肪族基、環状の不飽和C₃—C₉脂肪

- 族基、アラルキル基、アリール基、N-アリールアミノ基、アリールオキシ基、
 C_2-C_6 アルカノイル基、 $N-C_2-C_6$ アルカノイルアミノ基、アロイル基、 $N-C_1-C_6$ アルキルアミノ基、 N,N -ジ- C_1-C_6 アルキルアミノ基、 $N-C_1-C_{10}$ アルキルカルバモイル基、 $N-C_1-C_6$ アルキルスルファモイル基、 C_1-C_6 アルキルスルフィニル基、 C_1-C_6 アルキルスルホニル基、 $N-C_1-C_6$ アルキルスルホニルアミノ基、 C_1-C_6 アルコキシ基、 C_1-C_6 アルコキシカルボニル基、 $N-C_3-C_6$ シクロアルキルアミノ基、 C_3-C_6 シクロアルキルオキシ基及び $N-C_3-C_6$ シクロアルキルカルバモイル基からなる群から選択される置換基又は該置換基で置換されていてもよい、直鎖の飽和 C_1-C_9 脂肪族基、直鎖の不飽和 C_1-C_9 脂肪族基、分枝鎖の飽和 C_1-C_9 脂肪族基、分枝鎖の不飽和の C_1-C_9 脂肪族基若しくは C_1-C_6 アルコキシ基等が好ましく、特に例えば水素原子、アミノ基、ニトロ基、ハロゲン原子、ヒドロキシ基、アリール基、N-アリールアミノ基、 $N-C_1-C_6$ アルキルアミノ基、 N,N -ジ- C_1-C_6 アルキルアミノ基、 $N-C_1-C_{10}$ アルキルカルバモイル基、 C_1-C_6 アルコキシ基、 C_1-C_6 アルコキシカルボニル基及び $N-C_3-C_6$ シクロアルキルアミノ基からなる群から選択される置換基又は該置換基で置換されていてもよい、直鎖の飽和 C_1-C_9 脂肪族基、直鎖の不飽和 C_1-C_9 脂肪族基、分枝鎖の飽和 C_1-C_9 脂肪族基、分枝鎖の不飽和の C_1-C_9 脂肪族基若しくは C_1-C_6 アルコキシ基等が好適である。
- 20 R³及びR⁴は、同一又は異なって、
(1) 例えば水素原子、アジド基、アミジノ基、アミノ基、カルバモイル基、カルバモイルアミノ基、カルバモイルオキシ基、カルボキシリ基、グアニジノ基、シアノ基、スルファモイル基、スルホ基、ニトロ基、ハロゲン原子、ヒドロキシ基、ホルミル基、ホルミルアミノ基、環状の飽和 C_3-C_9 脂肪族基、環状の不飽和 C_3-C_9 脂肪族基、 C_2-C_6 アルカノイル基、 $N-C_2-C_6$ アルカノイルアミノ基、 $N-C_1-C_6$ アルキルアミノ基、 N,N -ジ- C_1-C_6 アルキルアミノ基、 $N-C_1-C_{10}$ アルキルカルバモイル基、 N,N -ジ- C_1-C_{10} アルキルカルバモイル基、 C_1-C_6 アルキルチオ基、 $N-C_1-C_6$ アルキルスルファモイル基、 C_1-C_6 アルキルスルフィニル基、 C_1-C_6 アルキルスルホニル基、 $N-C_1-$

C_6 アルキルスルホニルアミノ基、 C_1-C_6 アルコキシ基、 C_1-C_6 アルコキシカルボニル基、 $N-C_3-C_6$ シクロアルキルアミノ基、 C_3-C_6 シクロアルキルオキシ基及び $N-C_3-C_6$ シクロアルキルカルバモイル基からなる群から選択される置換基、

- 5 (2) 例えば該置換基で置換されていてもよい、直鎖の飽和 C_1-C_9 脂肪族基、直鎖の不飽和 C_1-C_9 脂肪族基、分枝鎖の飽和 C_1-C_9 脂肪族基及び分枝鎖の不飽和の C_1-C_9 脂肪族基からなる群から選択される置換基、
 (3) 例えばアリール基、アセナフチレニル基、アダマンチル基、アンスリル基、インデニル基、ノルボルニル基及びフェナンスリル基からなる群より選択される
- 10 1ないし3環性の C_7-C_{15} 炭素芳香環基又はイソオキサゾリル基、イソチアゾリル基、イミダゾリル基、オキサゾリル基、オキサジアゾリル基、チアゾリル基、チアジアゾリル基、チエニル基、トリアジニル基、トリアゾリル基、ピリジル基、ピラジニル基、ピリミジニル基、ピリダジニル基、ピラゾリル基、ピロリル基、ピラニル基、フリル基、フラザニル基、イミダゾリジニル基、イミダゾリニル基、
 15 テトラヒドロフラニル基、ピラゾリジニル基、ピラゾリニル基、ピペラジニル基、ビペリジニル基、ピロリジニル基、ピロリニル基及びモルホリノ基からなる群より選択される5又は6員のヘテロ環基若しくはアクリジニル基、イソキノリル基、イソインドリル基、インダゾリル基、インドリル基、インドリジニル基、エチレンジオキシフェニル基、カルバゾリル基、キナゾリニル基、キノキサリニル基、
 20 キノリジニル基、キノリル基、クマロニル基、クロメニル基、フェナンスリジニル基、フェナンスロリニル基、ジベンゾフラニル基、ジベンゾチオフェニル基、シンノリニル基、チオナフテニル基、ナフチリジニル基、フェナジニル基、フェナキサジニル基、フェノチアジニル基、フタラジニル基、ブテリジニル基、ブリニル基、ベンゾイミダゾリル基、ベンゾオキサゾリル基、ベンゾチアゾリル基、
 25 ベンゾトリアゾリル基、ベンゾフラニル基及びメチレンジオキシフェニル基からなる群より選択される窒素原子、酸素原子及び硫黄原子からなる群より選ばれるヘテロ原子を1環系当たり1ないし5個有する1ないし3環性の複素芳香環基又は該アリール基、該炭素芳香環基、該ヘテロ環基若しくは該複素芳香環基で置換されていてもよい、直鎖の飽和 C_1-C_9 脂肪族基、直鎖の不飽和 C_1-C_9 脂肪族

基、分枝鎖の飽和 C_1-C_9 脂肪族基若しくは分枝鎖の不飽和の C_1-C_9 脂肪族基等を示すか、又は

(4) R^3 及び R^4 は、一緒になって、直鎖の飽和 C_1-C_9 脂肪族基、直鎖の不飽和 C_1-C_9 脂肪族基、分枝鎖の飽和 C_1-C_9 脂肪族基若しくは分枝鎖の不飽和の C_1-C_9 脂肪族基又は5若しくは6員の飽和炭素環基若しくは5若しくは6員の不飽和の炭素環を形成する。

R^3 及び R^4 の置換基の態様を具体的に説明すると、

- (1) における好ましい置換基は、例えば水素原子、アジド基、アミジノ基、アミノ基、カルバモイル基、カルバモイルアミノ基、カルバモイルオキシ基、カルボキシル基、グアニジノ基、シアノ基、スルファモイル基、スルホ基、ニトロ基、ハロゲン原子、ヒドロキシ基、ホルミル基、ホルミルアミノ基、環状の飽和 C_3-C_9 脂肪族基、環状の不飽和 C_3-C_9 脂肪族基、 C_2-C_6 アルカノイル基、 $N-C_1-C_6$ アルキルアミノ基、 $N-C_1-C_{10}$ アルキルカルバモイル基、 C_1-C_6 アルキルチオ基、 $N-C_1-C_6$ アルキルスルファモイル基、 C_1-C_6 アルキルスルフィニル基、 C_1-C_6 アルキルスルホニル基、 $N-C_1-C_6$ アルキルカルボニル基及び $N-C_3-C_6$ シクロアルキルアミノ基からなる群から選択される置換基等が挙げられ、中でも、例えば水素原子、アジド基、アミジノ基、アミノ基、カルバモイル基、カルボキシル基、グアニジノ基、シアノ基、スルファモイル基、スルホ基、ニトロ基、ハロゲン原子、ヒドロキシ基、ホルミル基、環状の飽和 C_3-C_9 脂肪族基、環状の不飽和 C_3-C_9 脂肪族基、 $N-C_1-C_6$ アルキルアミノ基、 $N-C_1-C_{10}$ アルキルカルバモイル基、 C_1-C_6 アルキルチオ基、 C_1-C_6 アルコキシ基及び C_1-C_6 アルコキシカルボニル基からなる群から選択される置換基等が挙げられる。
- (2) における好ましい置換基は、例えば(1)で言及された置換基で置換されていてもよい、直鎖の飽和 C_1-C_9 脂肪族基、直鎖の不飽和 C_1-C_9 脂肪族基、分枝鎖の飽和 C_1-C_9 脂肪族基及び分枝鎖の不飽和の C_1-C_9 脂肪族基からなる群から選択される置換基、即ち例えば水素原子、アジド基、アミジノ基、アミノ基、カルバモイル基、カルバモイルアミノ基、カルバモイルオキシ基、カルボ

キシリル基、グアニジノ基、シアノ基、スルファモイル基、スルホ基、ニトロ基、ハロゲン原子、ヒドロキシ基、ホルミル基、ホルミルアミノ基、環状の飽和C₃—C₉脂肪族基、環状の不飽和C₃—C₉脂肪族基、C₂—C₆アルカノイル基、N—C₁—C₆アルキルアミノ基、N—C₁—C₁₀アルキルカルバモイル基、C₁—C₆

5 アルキルチオ基、N—C₁—C₆アルキルスルファモイル基、C₁—C₆アルキルスルフィニル基、C₁—C₆アルキルスルホニル基、N—C₁—C₆アルキルスルホニアミノ基、C₁—C₆アルコキシ基、C₁—C₆アルコキシカルボニル基及びN—C₃—C₆シクロアルキルアミノ基からなる群から選択される置換基で置換されてもよい、直鎖の飽和C₁—C₉脂肪族基、直鎖の不飽和C₁—C₉脂肪族基、

10 分枝鎖の飽和C₁—C₉脂肪族基及び分枝鎖の不飽和のC₁—C₉脂肪族基からなる群から選択される置換基等が挙げられ、中でも、例えば水素原子、アジド基、アミジノ基、アミノ基、カルバモイル基、カルボキシリル基、グアニジノ基、シアノ基、スルファモイル基、スルホ基、ニトロ基、ハロゲン原子、ヒドロキシ基、ホルミル基、環状の飽和C₃—C₉脂肪族基、環状の不飽和C₃—C₉脂肪族基、N—C₁—C₆

15 アルキルチオアミノ基、N—C₁—C₁₀アルキルカルバモイル基、C₁—C₆アルキルチオ基、C₁—C₆アルコキシ基及びC₁—C₆アルコキシカルボニル基からなる群から選択される置換基で置換されてもよい、直鎖の飽和C₁—C₉脂肪族基、直鎖の不飽和C₁—C₉脂肪族基、分枝鎖の飽和C₁—C₉脂肪族基及び分枝鎖の不飽和のC₁—C₉脂肪族基からなる群から選択される置換基等が挙げられる。

(3) における好ましい置換基は、例えばアリール基、アダマンチル基、アンスリル基、インデニル基、ノルボルニル基及びフェナンスリル基からなる群より選択される1ないし3環性のC₇—C₁₅炭素芳香環基又はイソオキサゾリル基、イソチアゾリル基、イミダゾリル基、オキサゾリル基、オキサジアゾリル基、チアゾリル基、チアジアゾリル基、チエニル基、トリアゾリル基、ピリジル基、ピラジニル基、ピリミジニル基、ピリダジニル基、ピラゾリル基、ピロリル基、ピラニル基、フリル基、イミダゾリジニル基、イミダゾリニル基、テトラヒドロフラニル基、ピラゾリジニル基、ピラゾリニル基、ピペラジニル基、ピペリジニル基、ピロリジニル基、ピロリニル基及びモルホリノ基からなる群より選択される5又

は6員のヘテロ環基若しくはイソキノリル基、イソインドリル基、インダゾリル基、インドリル基、エチレンジオキシフェニル基、カルバゾリル基、キナゾリニル基、キノキサリニル基、キノリジニル基、キノリル基、クマロニル基、クロメニル基、フェナンスリジニル基、フェナンスロリニル基、ジベンゾフラニル基、
 5 ジベンゾチオフェニル基、シンノリニル基、チオナフテニル基、ナフチリジニル基、フェナジニル基、フェナキサジニル基、ベンゾイミダゾリル基、ベンゾオキサゾリル基、ベンゾチアゾリル基、ベンゾトリアゾリル基、ベンゾフラニル基及びメチレンジオキシフェニル基からなる群より選択される窒素原子、酸素原子及び硫黄原子からなる群より選ばれるヘテロ原子を1環系当たり1ないし5個有する1ないし3環性の複素芳香環基又は該アリール基、該炭素芳香環基、該ヘテロ環基若しくは該複素芳香環基で置換されていてもよい、直鎖の飽和C₁—C₉脂肪族基、直鎖の不飽和C₁—C₉脂肪族基、分枝鎖の飽和C₁—C₉脂肪族基若しくは分枝鎖の不飽和のC₁—C₉脂肪族基等が好ましく、特に例えばアリール基、アンスリル基及びフェナンスリル基からなる群より選択される1ないし3環性のC
 10 ₇—C₁₅炭素芳香環基又はチエニル基、ピリジル基、ピラジニル基、ピリミジニル基、フリル基、テトラヒドロフラニル基及びモルホリノ基からなる群より選択される5又は6員のヘテロ環基若しくはエチレンジオキシフェニル基、ジベンゾフラニル基、ジベンゾチオフェニル基及びメチレンジオキシフェニル基からなる群より選択される窒素原子、酸素原子及び硫黄原子からなる群より選ばれるヘテロ原子を1環系当たり1ないし5個有する1ないし3環性の複素芳香環基又は該アリール基、該炭素芳香環基、該ヘテロ環基若しくは該複素芳香環基で置換されていてもよい、直鎖の飽和C₁—C₉脂肪族基、直鎖の不飽和C₁—C₉脂肪族基、分枝鎖の飽和C₁—C₉脂肪族基若しくは分枝鎖の不飽和のC₁—C₉脂肪族基等が好適である。
 15 (3)において、該アリール基、該1ないし3環性のC₇—C₁₅炭素芳香環基、該5又は6員のヘテロ環基、該窒素原子、酸素原子及び硫黄原子からなる群より選ばれるヘテロ原子を1環系当たり1ないし5個有する1ないし3環性の複素芳香環基又は該アリール基、該炭素芳香環基、該ヘテロ環基若しくは該複素芳香環基で置換されていてもよい、直鎖の飽和C₁—C₉脂肪族基、直鎖の不飽和C₁—
 20

C_9 脂肪族基、分枝鎖の飽和 C_1-C_9 脂肪族基若しくは分枝鎖の不飽和の C_1-C_9 脂肪族基等は、置換基を1又はそれ以上有することができる。なお、該置換基としては、置換基Rが有する置換基と同様の置換基を列挙することができる。

また、(4)における好ましい態様は、 R^3 及び R^4 が、一緒になって、直鎖の飽和 C_1-C_9 脂肪族基、直鎖の不飽和 C_1-C_9 脂肪族基、分枝鎖の飽和 C_1-C_9 脂肪族基若しくは分枝鎖の不飽和の C_1-C_9 脂肪族基又は5若しくは6員の飽和炭素環基若しくは5若しくは6員の不飽和の炭素環を形成する場合であり、特に直鎖の不飽和 C_1-C_9 脂肪族基又は5若しくは6員の飽和炭素環基を形成する場合が好適である。

10 従って、 R^3 及び R^4 は、同一又は異なって、

(1 a) 例えば水素原子、アジド基、アミジノ基、アミノ基、カルバモイル基、カルバモイルアミノ基、カルバモイルオキシ基、カルボキシル基、グアニジノ基、シアノ基、スルファモイル基、スルホ基、ニトロ基、ハロゲン原子、ヒドロキシ基、ホルミル基、ホルミルアミノ基、環状の飽和 C_3-C_9 脂肪族基、環状の不飽和 C_3-C_9 脂肪族基、 C_2-C_6 アルカノイル基、 $N-C_1-C_6$ アルキルアミノ基、 $N-C_1-C_{10}$ アルキルカルバモイル基、 C_1-C_6 アルキルチオ基、 $N-C_1-C_6$ アルキルスルファモイル基、 C_1-C_6 アルキルスルフィニル基、 C_1-C_6 アルキルスルホニル基、 $N-C_1-C_6$ アルキルスルホニアミノ基、 C_1-C_6 アルコキシ基、 C_1-C_6 アルコキシカルボニル基及び $N-C_3-C_6$ シクロアルキルアミノ基からなる群から選択される置換基等、

(2 a) 例えば該置換基で置換されていてもよい、直鎖の飽和 C_1-C_9 脂肪族基、直鎖の不飽和 C_1-C_9 脂肪族基、分枝鎖の飽和 C_1-C_9 脂肪族基及び分枝鎖の不飽和の C_1-C_9 脂肪族基からなる群から選択される置換基等

(3 a) 例えばアミノ基、カルバモイル基、カルバモイルアミノ基、カルバモイルオキシ基、カルボキシル基、ニトロ基、ハロゲン原子、ヒドロキシ基、環状の飽和 C_3-C_9 脂肪族基、環状の不飽和 C_3-C_9 脂肪族基、アラルキル基、 $N-$ アラルキルアミノ基、アラルキルオキシ基、アラルキルカルボニル基、 $N-$ アラルキルカルバモイル基、アリール基、 $N-$ アリールアミノ基、アリールオキシ基、アリールスルホニル基、アリールスルホニルオキシ基、 $N-$ アリールスルホニル

アミノ基、N-アリールスルホニルアミノC₁-C₁₀アルキルアミノ基、N-アリールスルホニルアミノC₁-C₁₀アルキルカルバモイル基、N-アリールスルホニルアミノC₁-C₆アルコキシカルボニル基、アリールスルファモイル基、アリールスルファモイルオキシ基、N-アリールスルファモイルC₁-C₁₀アルキ

5 ルカルバモイル基、アリールスルファモイルC₁-C₆アルコキシカルボニル基、N-アリールカルバモイル基、アロイル基、アロキシ基、N-(N-アロイルアミノ)C₁-C₁₀アルキルカルバモイル基、N-アロイルアミノC₁-C₁₀アルコキシカルボニル基、C₂-C₆アルカノイル基、N-C₂-C₆アルカノイルアミノ基、N-C₁-C₆アルキルアミノ基、N, N-ジ-C₁-C₆アルキルアミノ基、

10 N-C₁-C₁₀アルキルカルバモイル基、N-C₁-C₁₀アルキルチオカルバモイル基、N, N-ジ-C₁-C₁₀アルキルカルバモイル基、N, N-ジ-C₁-C₁アルキルチオカルバモイル基、N-C₂-C₆アルケニルカルバモイル基、N, N-ジ-C₂-C₆アルケニルカルバモイル基、N-アミノC₁-C₁₀アルキルカルバモイル基、N-C₁-C₆アルコキシC₁-C₁₀アルキルカルバモイル基、N-

15 C₁-C₆アルコキシカルボニルC₁-C₁₀アルキルカルバモイル基、N-C₁-C₆アルコキシカルボニルアミノC₁-C₁₀アルキルカルバモイル基、N-C₁-C₆アルコキシカルボニルアミノC₁-C₆アルコキシカルボニル基、C₁-C₆アルキ

ルチオ基、C₁-C₆アルキルスルフィニル基、C₁-C₆アルキルスルホニル基、N-C₁-C₆アルキルスルホニルアミノ基、C₁-C₆アルコキシ基、C₁-C₆

20 アルコキシカルボニル基、アミノC₁-C₆アルコキシカルボニル基、N-C₃-C₆シクロアルキルアミノ基、C₃-C₆シクロアルキルオキシ基、N-C₃-C₆シクロアルキルカルバモイル基及びN, N-ジ-C₃-C₆シクロアルキルカルバモイル基からなる群より選択される置換基、イソオキサゾリル基、イソチアゾリル基、イミダゾリル基、オキサゾリル基、オキサジアゾリル基、チアゾリル基、チアジアゾリル基、チエニル基、トリアゾリル基、ピリジル基、ピラジニル基、ピリミジニル基、ピリダジニル基、ピラゾリル基、ピロリル基、ピラニル基、フリル基、イミダゾリジニル基、イミダゾリニル基、テトラヒドロフラニル基、ピラゾリジニル基、ピラゾリニル基、ピペラジニル基、ピペリジニル基、ピロリジニル基、ピロリニル基及びモルホリ

25 :

ノ基からなる群より選択される 5 又は 6 員のヘテロ環基、イソキノリル基、イソ
インドリル基、インダゾリル基、インドリル基、エチレンジオキシフェニル基、
カルバゾリル基、キナゾリニル基、キノキサリニル基、キノリジニル基、キノリ
ル基、クマロニル基、クロメニル基、フェナンスリジニル基、フェナンスロリニ
ル基、ジベンゾフラニル基、ジベンゾチオフェニル基、シンノリニル基、チオナ
フテニル基、ナフチリジニル基、フェナジニル基、フェナキサジニル基、ベンゾ
イミダゾリル基、ベンゾオキサゾリル基、ベンゾチアゾリル基、ベンゾトリアゾ
リル基、ベンゾフラニル基及びメチレンジオキシフェニル基からなる群より選択
される窒素原子、酸素原子及び硫黄原子からなる群より選ばれるヘテロ原子を 1
10 環系当たり 1 ないし 5 個有する 1 ないし 3 環性の複素芳香環基並びに該ヘテロ環
基又は該複素芳香環基が置換した、N—C₁—C₁₀アルキルカルバモイル基、N—
C₁—C₁₀アルキルチオカルバモイル基、チオカルボニル基並びにカルボニル基
からなる群から選択される置換基並びに該置換基で置換されていてもよい、直鎖
の飽和 C₁—C₉ 脂肪族基、直鎖の不飽和 C₁—C₉ 脂肪族基、分枝鎖の飽和 C₁—
15 C₉ 脂肪族基、分枝鎖の不飽和の C₁—C₉ 脂肪族基、C₁—C₆ アルコキシ基及び
C₁—C₆ アルキルチオ基からなる群より選択される置換基からなる群より選択
される置換基を 1 又はそれ以上有していてもよい、アリール基、アダマンチル基、
アンスリル基、インデニル基、ノルボルニル基及びフェナンスリル基からなる群
より選択される 1 ないし 3 環性の C₇—C₁₅ 炭素芳香環基又はイソオキサゾリル
20 基、イソチアゾリル基、イミダゾリル基、オキサゾリル基、オキサジアゾリル基、
チアゾリル基、チアジアゾリル基、チエニル基、トリアゾリル基、ピリジル基、
ピラジニル基、ピリミジニル基、ピリダジニル基、ピラゾリル基、ピロリル基、
ピラニル基、フリル基、イミダゾリジニル基、イミダゾリニル基、テトラヒドロ
25 フラニル基、ピラゾリジニル基、ピラゾリニル基、ピペラジニル基、ピペリジニ
ル基、ピロリジニル基、ピロリニル基及びモルホリノ基からなる群より選択され
る 5 又は 6 員のヘテロ環基若しくはイソキノリル基、イソインドリル基、インダ
ゾリル基、インドリル基、エチレンジオキシフェニル基、カルバゾリル基、キナ
ゾリニル基、キノキサリニル基、キノリジニル基、キノリル基、クマロニル基、
クロメニル基、フェナンスリジニル基、フェナンスロリニル基、ジベンゾフラニ

- ル基、ジベンゾチオフェニル基、シンノリニル基、チオナフテニル基、ナフチリジニル基、フェナジニル基、フェナキサジニル基、ベンゾイミダゾリル基、ベンゾオキサゾリル基、ベンゾチアゾリル基、ベンゾトリアゾリル基、ベンゾフラニル基及びメチレンジオキシフェニル基からなる群より選択される窒素原子、酸素原子及び硫黄原子からなる群より選ばれるヘテロ原子を1環系当たり1ないし5個有する1ないし3環性の複素芳香環基又は該アリール基、該炭素芳香環基、該ヘテロ環基若しくは該複素芳香環基で置換されていてもよい、直鎖の飽和C₁—C₉脂肪族基、直鎖の不飽和C₁—C₉脂肪族基、分枝鎖の飽和C₁—C₉脂肪族基若しくは分枝鎖の不飽和のC₁—C₉脂肪族基等を示すか、又は
- 5 10 (4 a) R³及びR⁴は、一緒になって、直鎖の飽和C₁—C₉脂肪族基、直鎖の不飽和C₁—C₉脂肪族基、分枝鎖の飽和C₁—C₉脂肪族基若しくは分枝鎖の不飽和のC₁—C₉脂肪族基又は5若しくは6員の飽和炭素環基若しくは5若しくは6員の不飽和の炭素環を形成する場合等が好ましく(R^{3a}及びR^{4a})、特にR³及びR⁴は、同一又は異なって、
- 15 (1 b) 例えば水素原子、アジド基、アミジノ基、アミノ基、カルバモイル基、カルボキシル基、グアニジノ基、シアノ基、スルファモイル基、スルホ基、ニトロ基、ハロゲン原子、ヒドロキシ基、ホルミル基、環状の飽和C₃—C₉脂肪族基、環状の不飽和C₃—C₉脂肪族基、N—C₁—C₆アルキルアミノ基、N—C₁—C₁₀アルキルカルバモイル基、C₁—C₆アルキルチオ基及びC₁—C₆アルコキシ基、
- 20 C₁—C₆アルコキシカルボニル基からなる群から選択される置換基等、(2 b) 例えば該置換基で置換されていてもよい、直鎖の飽和C₁—C₉脂肪族基、直鎖の不飽和C₁—C₉脂肪族基、分枝鎖の飽和C₁—C₉脂肪族基及び分枝鎖の不飽和のC₁—C₉脂肪族基からなる群から選択される置換基等、
- (3 b) 例えばアミノ基、カルバモイル基、カルボキシル基、ニトロ基、ハロゲン原子、ヒドロキシ基、アラルキルカルボニル基、N—アラルキルカルバモイル基、アリール基、アロイル基、C₂—C₆アルカノイル基、N—C₁—C₆アルキルアミノ基、N—C₁—C₁₀アルキルカルバモイル基、N—C₁—C₁₀アルキルチオカルバモイル基、N, N—ジー—C₁—C₁₀アルキルカルバモイル基、N, N—ジー—C₁—C₁₀アルキルチオカルバモイル基、N—C₂—C₆アルケニルカルバモイル

基、N, N-ジ-C₂-C₆アルケニルカルバモイル基、N-アミノC₁-C₁₀アルキルカルバモイル基、N-C₁-C₆アルコキシC₁-C₁₀アルキルカルバモイル基、N-C₁-C₆アルコキシカルボニルC₁-C₁₀アルキルカルバモイル基、C₁-C₆アルコキシ基、アミノC₁-C₆アルコキシカルボニル基、N-C₃-C₆シクロアルキルアミノ基、N, N-ジ-C₃-C₆シクロアルキルアミノ基、C₃-C₆シクロアルキルオキシ基、N-C₃-C₆シクロアルキルカルバモイル基及びN, N-ジ-C₃-C₆シクロアルキルカルバモイル基からなる群より選択される置換基、チエニル基、ピリジル基、ピラジニル基、ピリミジニル基、フリル基、テトラヒドロフラニル基及びモルホリノ基からなる群より選択される5又は6員のヘテロ環基、エチレンジオキシフェニル基、ジベンゾフラニル基、ジベンゾチオフェニル基及びメチレンジオキシフェニル基からなる群より選択される窒素原子、酸素原子及び硫黄原子からなる群より選ばれるヘテロ原子を1環系当たり1ないし5個有する1ないし3環性の複素芳香環基並びに該ヘテロ環基又は該複素芳香環基が置換した、N-C₁-C₁₀アルキルカルバモイル基、N-C₁-C₁₀アルキルチオカルバモイル基、チオカルボニル基並びにカルボニル基からなる群から選択される置換基並びに該置換基で置換されていてもよい、直鎖の飽和C₁-C₉脂肪族基、直鎖の不飽和C₁-C₉脂肪族基、分枝鎖の飽和C₁-C₉脂肪族基、分枝鎖の不飽和のC₁-C₉脂肪族基及びC₁-C₆アルコキシ基からなる群より選択される置換基からなる群より選択される置換基を1又はそれ以上有してもよい、アリール基、アンスリル基及びフェナンスリル基からなる群より選択される1ないし3環性のC₇-C₁₅炭素芳香環基又はチエニル基、ピリジル基、ピラジニル基、ピリミジニル基、フリル基、テトラヒドロフラニル基及びモルホリノ基からなる群より選択される5又は6員のヘテロ環基若しくはエチレンジオキシフェニル基、ジベンゾフラニル基、ジベンゾチオフェニル基及びメチレンジオキシフェニル基からなる群より選択される窒素原子、酸素原子及び硫黄原子からなる群より選ばれるヘテロ原子を1環系当たり1ないし5個有する1ないし3環性の複素芳香環基又は該アリール基、該炭素芳香環基、該ヘテロ環基若しくは該複素芳香環基で置換されていてもよい、直鎖の飽和C₁-C₉脂肪族基、直鎖の不飽和C₁-C₉脂肪族基、分枝鎖の飽和C₁-C₉脂肪族基若しくは分枝鎖の不飽

和の $C_1 - C_9$ 脂肪族基等を示すか、又は

(4 b) R^3 及び R^4 は、一緒になって、直鎖の不飽和 $C_1 - C_9$ 脂肪族基又は 5 若しくは 6 員の飽和炭素環基を形成する場合等 (R^{3b} 及び R^{4b}) が好適である。

- X_1 は、例えば酸素原子、硫黄原子又は基 : NR^5 (ここにおいて、 R^5 は、水素原子、ハロゲン原子、ヒドロキシ基、 $N-C_1-C_6$ アルキルスルホニルアミノ基、 C_1-C_6 アルコキシ基、 C_1-C_6 アルコキシカルボニル基、 C_2-C_6 アルカノイル基、カルバモイル基及び $N-C_1-C_{10}$ アルキルカルバモイル基からなる群から選択される置換基又は該置換基で置換されていてもよい、直鎖の飽和 C_1-C_9 脂肪族基、直鎖の不飽和 C_1-C_9 脂肪族基、分枝鎖の飽和 C_1-C_9 脂肪族基若しくは分枝鎖の不飽和の C_1-C_9 脂肪族基を示す) 等を示し、中でも例えば酸素原子、硫黄原子又は基 : NR^{5a} (ここにおいて、 R^{5a} は、水素原子、ハロゲン原子、ヒドロキシ基、 $N-C_1-C_6$ アルキルスルホニルアミノ基、 C_1-C_6 アルコキシ基、 C_1-C_6 アルコキシカルボニル基、 C_2-C_6 アルカノイル基、カルバモイル基及び $N-C_1-C_{10}$ アルキルカルバモイル基からなる群から選択される置換基又は該置換基で置換されていてもよい、直鎖の飽和 C_1-C_9 脂肪族基、直鎖の不飽和 C_1-C_9 脂肪族基、分枝鎖の飽和 C_1-C_9 脂肪族基若しくは分枝鎖の不飽和の C_1-C_9 脂肪族基を示す) 等が好ましく、特に例えば酸素原子又は基 : NR^{5b} (ここにおいて、 R^{5b} は、水素原子、ヒドロキシ基、 C_1-C_6 アルコキシ基、 C_1-C_6 アルコキシカルボニル基及び $N-C_1-C_{10}$ アルキルカルバモイル基からなる群から選択される置換基又は該置換基で置換されていてもよい、直鎖の飽和 C_1-C_9 脂肪族基、直鎖の不飽和 C_1-C_9 脂肪族基、分枝鎖の飽和 C_1-C_9 脂肪族基若しくは分枝鎖の不飽和の C_1-C_9 脂肪族基を示す) 等が好適である。

X_2 は、例えば酸素原子又は硫黄原子等を示す。

- 25 Y は、例えば酸素原子、硫黄原子又は基 : NR^5 若しくは基 : CR^6R^7 (ここにおいて、 R^6 は、水素原子、ハロゲン原子、ヒドロキシ基、 $N-C_1-C_6$ アルキルスルホニルアミノ基、 C_1-C_6 アルコキシ基、 C_1-C_6 アルコキシカルボニル基、 C_2-C_6 アルカノイル基、カルバモイル基及び $N-C_1-C_{10}$ アルキルカルバモイル基からなる群から選択される置換基又は該置換基で置換されていても

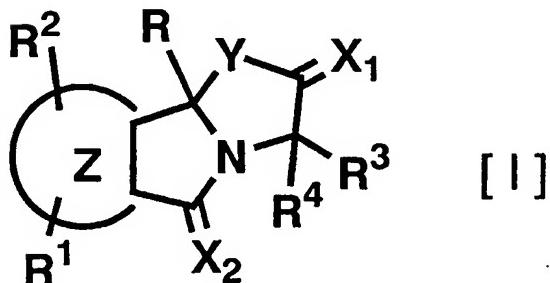
よい、直鎖の飽和 C_1-C_9 脂肪族基、直鎖の不飽和 C_1-C_9 脂肪族基、分枝鎖の飽和 C_1-C_9 脂肪族基若しくは分枝鎖の不飽和の C_1-C_9 脂肪族基、 R^7 は、水素原子又は C_1-C_6 アルキル基を示し、 R^5 は、前記の意味を有する)等を示し、中でも例えば酸素原子、硫黄原子又は基: NR^{5a} 若しくは基: $CR^{6a}R^{7a}$ (ここにおいて、 R^{6a} は、水素原子、ハロゲン原子、ヒドロキシ基、 $N-C_1-C_6$ アルキルスルホニルアミノ基、 C_1-C_6 アルコキシ基、 C_1-C_6 アルコキシカルボニル基、 C_2-C_6 アルカノイル基、カルバモイル基及び $N-C_1-C_{10}$ アルキルカルバモイル基からなる群から選択される置換基又は該置換基で置換されていてもよい、直鎖の飽和 C_1-C_9 脂肪族基、直鎖の不飽和 C_1-C_9 脂肪族基、分枝鎖の飽和 C_1-C_9 脂肪族基若しくは分枝鎖の不飽和の C_1-C_9 脂肪族基、 R^{7a} は、水素原子又は C_1-C_6 アルキル基を示し、 R^{5a} は、前記の意味を有する)等が好ましく、特に例えば酸素原子、硫黄原子又は基: $CR^{6b}R^{7b}$ (ここにおいて、 R^{6b} は、水素原子、ヒドロキシ基、 C_1-C_6 アルコキシ基、 C_1-C_6 アルコキシカルボニル基及び $N-C_1-C_{10}$ アルキルカルバモイル基からなる群から選択される置換基又は該置換基で置換されていてもよい、直鎖の飽和 C_1-C_9 脂肪族基、直鎖の不飽和 C_1-C_9 脂肪族基、分枝鎖の飽和 C_1-C_9 脂肪族基若しくは分枝鎖の不飽和の C_1-C_9 脂肪族基、 R^{7b} は、水素原子又は C_1-C_6 アルキル基を示す)等が好適である。

Z は、例えば縮合アリール基、アセナフチレニル基、アダマンチル基、アンスリル基、インダニル基、インデニル基、 C_6-C_8 シクロアルカニル基、 C_6-C_8 シクロアルカジエニル基、 C_6-C_8 シクロアルケニル基、ノルボルニル基、フェナンスリル基及びフレオレニル基からなる群より選択される2ないし3環性の飽和若しくは不飽和の C_6-C_{15} 縮合炭素環基又はイソキノリル基、イソインドリル基、インダゾリル基、インドリル基、インドリジニル基、エチレンジオキシフェニル基、キナゾリニル基、キノキサリニル基、キノリジニル基、キノリル基、クマロニル基、クロメニル基、チオナフテニル基、ナフチリジニル基、ピリジル基、ピラジニル基、ピリミジニル基、ピリダジニル基、ピラニル基、フタラジル基、ベンゾイミダゾリル基、ベンゾオキサゾリル基、ベンゾチアゾリル基、ベンゾトリアゾリル基、ベンゾフラニル基及びメチレンジオキシフェニル基からなる群よ

り選択される6員のヘテロ環基若しくは窒素原子、酸素原子及び硫黄原子からなる群より選ばれるヘテロ原子を1環系当たり1ないし5個有する2ないし3環性の縮合複素芳香環基等を示し、中でも例えば縮合アリール基、アダマンチル基、アンスリル基、インダニル基、インデニル基、C₆—C₈シクロアルカニル基、C₅—C₈シクロアルカジエニル基、C₆—C₈シクロアルケニル基、ノルポルニル基及びフェナンスリル基からなる群より選択される2ないし3環性の飽和若しくは不飽和のC₆—C₁₅縮合炭素環基又はエチレンジオキシフェニル基、ピリジル基、ピラジニル基、ピリミジニル基、ピリダジニル基、ベンゾイミダゾリル基、ベンゾオキサゾリル基、ベンゾチアゾリル基、ベンゾトリアゾリル基、ベンゾフラニル基及びメチレンジオキシフェニル基からなる群より選択される6員のヘテロ環基若しくは窒素原子、酸素原子及び硫黄原子からなる群より選ばれるヘテロ原子を1環系当たり1ないし5個有する2ないし3環性の縮合複素芳香環基等が好ましく、特に例えば縮合アリール基、アンスリル基、C₆—C₈シクロアルカニル基、C₆—C₈シクロアルカジエニル基及びC₆—C₈シクロアルケニル基からなる群より選択される2ないし3環性の飽和若しくは不飽和のC₆—C₁₅縮合炭素環基又はエチレンジオキシフェニル基、ピリジル基、ピラジニル基、ピリミジニル基、ピリダジニル基及びメチレンジオキシフェニル基からなる群より選択される6員のヘテロ環基若しくは窒素原子、酸素原子及び硫黄原子からなる群より選ばれるヘテロ原子を1環系当たり1ないし5個有する2ないし3環性の縮合複素芳香環基等が好適である。

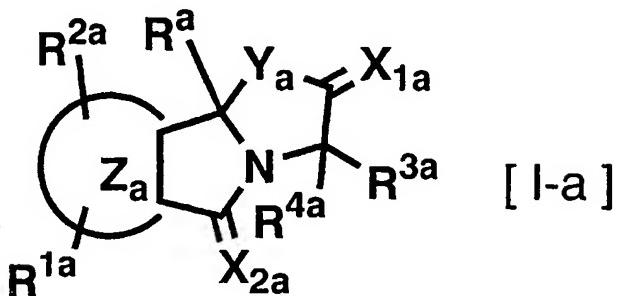
次に、本発明の一般式〔I〕の化合物について説明する。

一般式〔I〕



[式中、R、R¹、R²、R³、R⁴、X₁、X₂、Y及びZは、前記の意味を有する]

で表される化合物中、好適な化合物は、一般式 [I - a]



- [式中、R^aは、アミノ基、カルバモイル基、カルバモイルアミノ基、カルバモイルオキシ基、カルボキシリル基、ニトロ基、ハロゲン原子、ヒドロキシ基、環状の飽和C₃—C₉脂肪族基、環状の不飽和C₃—C₉脂肪族基、アラルキル基、N—アラルキルアミノ基、アラルキルオキシ基、アラルキルカルボニル基、N—アラルキルカルバモイル基、アリール基、N—アリールアミノ基、アリールオキシ基、アリールスルホニル基、アリールスルホニルオキシ基、N—アリールスルホニルアミノ基、N—アリールスルホニルアミノC₁—C₁₀アルキルアミノ基、N—アリールスルホニルアミノC₁—C₁₀アルキルカルバモイル基、N—アリールスルホニルカルボニル基、アリールスルファモイル基、アリールスルファモイルオキシ基、N—アリールスルファモイルC₁—C₁₀アルキルカルバモイル基、アリールスルファモイルC₁—C₆アルコキシカルボニル基、N—アリールカルバモイル基、アロイル基、アロキシ基、N—(N—アロイルアミノ)C₁—C₁₀アルキルカルバモイル基、N—アロイルアミノC₁—C₁₀アルコキシカルボニル基、C₂—C₆アルカノイル基、N—C₂—C₆アルカノイルアミノ基、N—C₁—C₆アルキルアミノ基、N, N—ジ—C₁—C₆アルキルアミノ基、N—C₁—C₁₀アルキルカルバモイル基、N, N—ジ—C₁—C₁₀アルキルカルバモイル基、N, N—ジ—C₁—C₁—アルキルチオカルバモイル基、N—C₂—C₆アルケニルカルバモイル基、N, N—ジ—C₂—C₆アルケニルカルバモイル基、N—アミノC₁—C₁₀アルキルカルバモイル基、N—C₁—C₆アルコキシカルボニルC₁—C₁₀アルキルカルバモイル基、N—C₁—C₆アルコキシカルボニルアミノC₁—C₁₀アルキルカルバモイル基、N—C₁—C₆

アルコキシカルボニルアミノ $C_1 - C_6$ アルコキシカルボニル基、 $C_1 - C_6$ アルキルチオ基、 $C_1 - C_6$ アルキルスルフィニル基、 $C_1 - C_6$ アルキルスルホニル基、 $N - C_1 - C_6$ アルキルスルホニルアミノ基、 $C_1 - C_6$ アルコキシ基、 $C_1 - C_6$ アルコキシカルボニル基、アミノ $C_1 - C_6$ アルコキシカルボニル基、 $N - C_3 - C_6$ シクロアルキルアミノ基、 $N, N - \text{ジ} - C_3 - C_6$ シクロアルキルアミノ基、 $C_3 - C_6$ シクロアルキルオキシ基、 $N - C_3 - C_6$ シクロアルキルカルバモイル基及び $N, N - \text{ジ} - C_3 - C_6$ シクロアルキルカルバモイル基からなる群より選択される置換基、イソオキサゾリル基、イソチアゾリル基、イミダゾリル基、オキサゾリル基、オキサジアゾリル基、チアゾリル基、チアジアゾリル基、チエニル基、
 10 トリアゾリル基、ピリジル基、ピラジニル基、ピリミジニル基、ピリダジニル基、ピラゾリル基、ピロリル基、ピラニル基、フリル基、イミダゾリジニル基、イミダゾリニル基、テトラヒドロフラニル基、ピラゾリジニル基、ピラゾリニル基、ピペラジニル基、ピペリジニル基、ピロリジニル基、ピロリニル基及びモルホリノ基からなる群より選択される 5 又は 6 員のヘテロ環基、イソキノリル基、イソインドリル基、インダゾリル基、インドリル基、エチレンジオキシフェニル基、カルバゾリル基、キナゾリニル基、キノキサリニル基、キノリジニル基、キノリル基、クマロニル基、クロメニル基、フェナンスリジニル基、フェナンスロリニル基、ジベンゾフラニル基、ジベンゾチオフェニル基、シンノリニル基、チオナフテニル基、ナフチリジニル基、フェナジニル基、フェナキサジニル基、ベンゾイミダゾリル基、ベンゾオキサゾリル基、ベンゾチアゾリル基、ベンゾトリアゾリル基、ベンゾフラニル基及びメチレンジオキシフェニル基からなる群より選択される窒素原子、酸素原子及び硫黄原子からなる群より選ばれるヘテロ原子を 1 環系当たり 1 ないし 5 個有する 1 ないし 3 環性の複素芳香環基並びに該ヘテロ環基又は該複素芳香環基が置換した、 $N - C_1 - C_{10}$ アルキルカルバモイル基、 $N - C_1 - C_{10}$ アルキルチオカルバモイル基、チオカルボニル基並びにカルボニル基からなる群から選択される置換基並びに該置換基で置換されていてもよい、直鎖の飽和 $C_1 - C_9$ 脂肪族基、直鎖の不飽和 $C_1 - C_9$ 脂肪族基、分枝鎖の飽和 $C_1 - C_9$ 脂肪族基、分枝鎖の不飽和の $C_1 - C_9$ 脂肪族基、 $C_1 - C_6$ アルコキシ基及び $C_1 - C_6$ アルキルチオ基からなる群より選択される置換基からなる群より選択

される置換基を 1 又はそれ以上有していてもよい、アリール基、アダマンチル基、アンスリル基、インデニル基、ノルボルニル基及びフェナンスリル基からなる群より選択される 1 ないし 3 環性の $C_7 - C_{15}$ 炭素芳香環基又はイソオキサゾリル基、イソチアゾリル基、イミダゾリル基、オキサゾリル基、オキサジアゾリル基、
 5 チアゾリル基、チアジアゾリル基、チエニル基、トリアゾリル基、ピリジル基、ピラジニル基、ピリミジニル基、ピリダジニル基、ピラゾリル基、ピロリル基、ピラニル基、フリル基、イミダゾリジニル基、イミダゾリニル基、テトラヒドロフラニル基、ピラゾリジニル基、ピラゾリニル基、ピペラジニル基、ピペリジニル基、ピロリジニル基、ピロリニル基及びモルホリノ基からなる群より選択され
 10 る 5 又は 6 員のヘテロ環基若しくはイソキノリル基、イソインドリル基、インダゾリル基、インドリル基、エチレンジオキシフェニル基、カルバゾリル基、キナゾリニル基、キノキサリニル基、キノリジニル基、キノリル基、クマロニル基、クロメニル基、フェナンスリジニル基、フェナンスロリニル基、ジベンゾフラニル基、ジベンゾチオフェニル基、シンノリニル基、チオナフテニル基、ナフチリジニル基、フェナジニル基、フェナキサジニル基、ベンゾイミダゾリル基、ベンゾオキサゾリル基、ベンゾチアゾリル基、ベンゾトリアゾリル基、ベンゾフラニル基及びメチレンジオキシフェニル基からなる群より選択される窒素原子、酸素原子及び硫黄原子からなる群より選ばれるヘテロ原子を 1 環系当たり 1 ないし 5 個有する 1 ないし 3 環性の複素芳香環基、 R^{1a} 及び R^{2a} は、同一又は異なって、
 20 水素原子、アミノ基、カルボキシル基、シアノ基、スルファモイル基、スルホ基、ニトロ基、ハロゲン原子、ヒドロキシ基、ホルミル基、環状の飽和 $C_3 - C_9$ 脂肪族基、環状の不飽和 $C_3 - C_9$ 脂肪族基、アラルキル基、アリール基、N-アリールアミノ基、アリールオキシ基、 $C_2 - C_6$ アルカノイル基、 $N - C_2 - C_6$ アルカノイルアミノ基、アロイル基、 $N - C_1 - C_6$ アルキルアミノ基、N, N-ジ- $C_1 - C_6$ アルキルアミノ基、 $N - C_1 - C_{10}$ アルキルカルバモイル基、 $N - C_1 - C_6$ アルキルスルファモイル基、 $C_1 - C_6$ アルキルスルフィニル基、 $C_1 - C_6$ アルキルスルホニル基、 $N - C_1 - C_6$ アルキルスルホニアミノ基、 $C_1 - C_6$ アルコキシ基、 $C_1 - C_6$ アルコキカルボニル基、 $N - C_3 - C_6$ シクロアルキルアミノ基、 $C_3 - C_6$ シクロアルキルオキシ基及び $N - C_3 - C_6$ シクロアルキルカルバモ
 25

イル基からなる群から選択される置換基又は該置換基で置換されていてよい、直鎖の飽和C₁—C₉脂肪族基、直鎖の不飽和C₁—C₉脂肪族基、分枝鎖の飽和C₁—C₉脂肪族基、分枝鎖の不飽和のC₁—C₉脂肪族基若しくはC₁—C₆アルコキシ基、R^{3a}及びR^{4a}は、同一又は異なって、水素原子、アジド基、アミジノ基、
 5 アミノ基、カルバモイル基、カルバモイルアミノ基、カルバモイルオキシ基、カルボキシル基、グアニジノ基、シアノ基、スルファモイル基、スルホ基、ニトロ基、ハロゲン原子、ヒドロキシ基、ホルミル基、ホルミルアミノ基、環状の飽和C₃—C₉脂肪族基、環状の不飽和C₃—C₉脂肪族基、C₂—C₆アルカノイル基、N—C₁—C₆アルキルアミノ基、N—C₁—C₁₀アルキルカルバモイル基、C₁—C₆アルキルチオ基、N—C₁—C₆アルキルスルファモイル基、C₁—C₆アルキルスルフィニル基、C₁—C₆アルキルスルホニル基、N—C₁—C₆アルキルスルホニルアミノ基、C₁—C₆アルコキシ基、C₁—C₆アルコキシカルボニル基及びN—C₃—C₆シクロアルキルアミノ基からなる群から選択される置換基、該置換基で置換されていてよい、直鎖の飽和C₁—C₉脂肪族基、直鎖の不飽和C₁—C₉脂肪族基、分枝鎖の飽和C₁—C₉脂肪族基及び分枝鎖の不飽和のC₁—C₉脂肪族基からなる群から選択される置換基アミノ基、カルバモイル基、カルバモイ
 10 ルアミノ基、カルバモイルオキシ基、カルボキシル基、ニトロ基、ハロゲン原子、ヒドロキシ基、環状の飽和C₃—C₉脂肪族基、環状の不飽和C₃—C₉脂肪族基、アラルキル基、N—アラルキルアミノ基、アラルキルオキシ基、アラルキルカルボニル基、N—アラルキルカルバモイル基、アリール基、N—アリールアミノ基、アリールオキシ基、アリールスルホニル基、アリールスルホニルオキシ基、N—アリールスルホニルアミノ基、N—アリールスルホニルアミノC₁—C₁₀アルキ
 15 ルアミノ基、N—アリールスルホニルアミノC₁—C₁₀アルキルカルバモイル基、N—アリールスルホニルアミノC₁—C₆アルコキシカルボニル基、アリールスル
 20 ファモイル基、アリールスルファモイルオキシ基、N—アリールスルファモイルC₁—C₁₀アルキルカルバモイル基、アリールスル
 25 ファモイル基、アリールスルファモイル基、アリールスルホニル基、アロイル基、アロキシ基、N—(N—アロイルアミノ)C₁—C₁₀アルキルカルバモイル基、N—アロイルアミノC₁—C₁₀アルコキシカルボニル基、C₂—C₆アルカノイル基、N—C₂—C₆

アルカノイルアミノ基、N—C₁—C₆アルキルアミノ基、N、N—ジ—C₁—C₆アルキルアミノ基、N—C₁—C₁₀アルキルカルバモイル基、N—C₁—C₁₀アルキルチオカルバモイル基、N、N—ジ—C₁—C₁₀アルキルカルバモイル基、N、N—ジ—C₁—C₁₀アルキルチオカルバモイル基、N—C₂—C₆アルケニルカル

5 バモイル基、N、N—ジ—C₂—C₆アルケニルカルバモイル基、N—アミノC₁—C₁₀アルキルカルバモイル基、N—C₁—C₆アルコキシC₁—C₁₀アルキルカルバモイル基、N—C₁—C₆アルコキシカルボニルC₁—C₁₀アルキルカルバモイル基、N—C₁—C₆アルコキシカルボニルアミノC₁—C₁₀アルキルカルバモイル基、N—C₁—C₆アルコキシカルボニルアミノC₁—C₆アルコキシカルボニル

10 基、C₁—C₆アルキルチオ基、C₁—C₆アルキルスルフィニル基、C₁—C₆アルキルスルホニル基、N—C₁—C₆アルキルスルホニルアミノ基、C₁—C₆アルコキシ基、C₁—C₆アルコキシカルボニル基、アミノC₁—C₆アルコキシカルボニル基、N—C₃—C₆シクロアルキルアミノ基、N、N—ジ—C₃—C₆シクロアルキルアミノ基、C₃—C₆シクロアルキルオキシ基、N—C₃—C₆シクロアル

15 キルカルバモイル基及びN、N—ジ—C₃—C₆シクロアルキルカルバモイル基からなる群より選択される置換基、イソオキサゾリル基、イソチアゾリル基、イミダゾリル基、オキサゾリル基、オキサジアゾリル基、チアゾリル基、チアジアゾリル基、チエニル基、トリアゾリル基、ピリジル基、ピラジニル基、ピリミジニル基、ピリダジニル基、ピラゾリル基、ピロリル基、ピラニル基、フリル基、イ

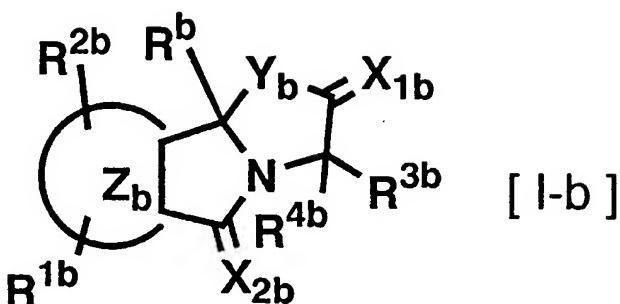
20 ミダゾリジニル基、イミダゾリニル基、テトラヒドロフラニル基、ピラゾリジニル基、ピラゾリニル基、ピペラジニル基、ピペリジニル基、ピロリジニル基、ピロリニル基及びモルホリノ基からなる群より選択される5又は6員のヘテロ環基、イソキノリル基、イソインドリル基、インダゾリル基、インドリル基、エチレンジオキシフェニル基、カルバゾリル基、キナゾリニル基、キノキサリニル基、キ

25 ノリジニル基、キノリル基、クマロニル基、クロメニル基、フェナンスリジニル基、フェナンスロリニル基、ジベンゾフラニル基、ジベンゾチオフェニル基、シンノリニル基、チオナフテニル基、ナフチリジニル基、フェナジニル基、フェナキサジニル基、ベンゾイミダゾリル基、ベンゾオキサゾリル基、ベンゾチアゾリル基、ベンゾトリアゾリル基、ベンゾフラニル基及びメチレンジオキシフェニル

基からなる群より選択される窒素原子、酸素原子及び硫黄原子からなる群より選ばれるヘテロ原子を1環系当たり1ないし5個有する1ないし3環性の複素芳香環基並びに該ヘテロ環基又は該複素芳香環基が置換した、N—C₁—C₁₀アルキルカルバモイル基、N—C₁—C₁₀アルキルチオカルバモイル基、チオカルボニル基並びにカルボニル基からなる群から選択される置換基並びに該置換基で置換されていてもよい、直鎖の飽和C₁—C₉脂肪族基、直鎖の不飽和C₁—C₉脂肪族基、分枝鎖の飽和C₁—C₉脂肪族基、分枝鎖の不飽和のC₁—C₉脂肪族基、C₁—C₆アルコキシ基及びC₁—C₆アルキルチオ基からなる群より選択される置換基からなる群より選択される置換基を1又はそれ以上有していてもよい、アリール基、アダマンチル基、アンスリル基、インデニル基、ノルボルニル基及びフェナントスリル基からなる群より選択される1ないし3環性のC₇—C₁₅炭素芳香環基又はイソオキサゾリル基、イソチアゾリル基、イミダゾリル基、オキサゾリル基、オキサジアゾリル基、チアゾリル基、チアジアゾリル基、チエニル基、トリアゾリル基、ピリジル基、ピラジニル基、ピリミジニル基、ピリダジニル基、ピラゾリル基、ピロリル基、ピラニル基、フリル基、イミダゾリジニル基、イミダゾリニル基、テトラヒドロフラニル基、ピラゾリジニル基、ピラゾリニル基、ピペラジニル基、ピペリジニル基、ピロリジニル基、ピロリニル基及びモルホリノ基からなる群より選択される5又は6員のヘテロ環基若しくはイソキノリル基、イソインドリル基、インダゾリル基、インドリル基、エチレンジオキシフェニル基、20 カルバゾリル基、キナゾリニル基、キノキサリニル基、キノリジニル基、キノリル基、クマロニル基、クロメニル基、フェナンスリジニル基、フェナンスロリニル基、ジベンゾフラニル基、ジベンゾチオフェニル基、シンノリニル基、チオナフテニル基、ナフチリジニル基、フェナジニル基、フェナキサジニル基、ベンゾイミダゾリル基、ベンゾオキサゾリル基、ベンゾチアゾリル基、ベンゾトリアゾリル基、ベンゾフラニル基及びメチレンジオキシフェニル基からなる群より選択される窒素原子、酸素原子及び硫黄原子からなる群より選ばれるヘテロ原子を1環系当たり1ないし5個有する1ないし3環性の複素芳香環基又は該アリール基、該炭素芳香環基、該ヘテロ環基若しくは該複素芳香環基で置換されていてもよい、直鎖の飽和C₁—C₉脂肪族基、直鎖の不飽和C₁—C₉脂肪族基、分枝鎖の飽和C

$C_1 - C_9$ 脂肪族基若しくは分枝鎖の不飽和の $C_1 - C_9$ 脂肪族基を示すか、又は R^3
 a 及び R^4 a は、一緒になって、直鎖の飽和 $C_1 - C_9$ 脂肪族基、直鎖の不飽和 $C_1 - C_9$ 脂肪族基、分枝鎖の飽和 $C_1 - C_9$ 脂肪族基若しくは分枝鎖の不飽和の $C_1 - C_9$ 脂肪族基又は 5 若しくは 6 員の飽和炭素環基若しくは 5 若しくは 6 員の不飽和
5 の炭素環を形成し、 X_{1a} は、酸素原子、硫黄原子又は基： NR^{5a} （ここにおいて、 R^{5a} は、水素原子、ハロゲン原子、ヒドロキシ基、 $N - C_1 - C_6$ アルキルスルホニルアミノ基、 $C_1 - C_6$ アルコキシ基、 $C_1 - C_6$ アルコキシカルボニル基、 $C_2 - C_6$ アルカノイル基、カルバモイル基及び $N - C_1 - C_{10}$ アルキルカルバモイル基からなる群から選択される置換基又は該置換基で置換されていてもよい、直鎖の
10 飽和 $C_1 - C_9$ 脂肪族基、直鎖の不飽和 $C_1 - C_9$ 脂肪族基、分枝鎖の飽和 $C_1 - C_9$ 脂肪族基若しくは分枝鎖の不飽和の $C_1 - C_9$ 脂肪族基を示す）、 X_{2a} は、酸素原子又は硫黄原子、 Y_a は、酸素原子、硫黄原子又は基： NR^{5a} 若しくは基： CR^6
 $^a R^7$ a （ここにおいて、 R^6 a は、水素原子、ハロゲン原子、ヒドロキシ基、 $N - C_1 - C_6$ アルキルスルホニルアミノ基、 $C_1 - C_6$ アルコキシ基、 $C_1 - C_6$ アルコ
15 キシカルボニル基、 $C_2 - C_6$ アルカノイル基、カルバモイル基及び $N - C_1 - C_{10}$ アルキルカルバモイル基からなる群から選択される置換基又は該置換基で置換されていてもよい、直鎖の飽和 $C_1 - C_9$ 脂肪族基、直鎖の不飽和 $C_1 - C_9$ 脂肪族基、分枝鎖の飽和 $C_1 - C_9$ 脂肪族基若しくは分枝鎖の不飽和の $C_1 - C_9$ 脂肪族基、 R^7 a は、水素原子又は $C_1 - C_6$ アルキル基を示し、 R^{5a} は、前記の意味を有する）、
20 Z_a は、縮合アリール基、アダマンチル基、アンスリル基、インダニル基、インデニル基、 $C_6 - C_8$ シクロアルカニル基、 $C_6 - C_8$ シクロアルカジエニル基、 $C_6 - C_8$ シクロアルケニル基、ノルボルニル基及びフェナンスリル基からなる群より選択される 2 ないし 3 環性の飽和若しくは不飽和の $C_6 - C_{15}$ 縮合炭素環基又はエチレンジオキシフェニル基、ピリジル基、ピラジニル基、ピリミジニル基、
25 ピリダジニル基、ベンゾイミダゾリル基、ベンゾオキサゾリル基、ベンゾチアゾリル基、ベンゾトリアゾリル基、ベンゾフラニル基及びメチレンジオキシフェニル基からなる群より選択される 6 員のヘテロ環基若しくは窒素原子、酸素原子及び硫黄原子からなる群より選ばれるヘテロ原子を 1 環系当たり 1 ないし 5 個有する 2 ないし 3 環性の縮合複素芳香環基を示す]で化合物であり、特に、一般式 [I -

b]



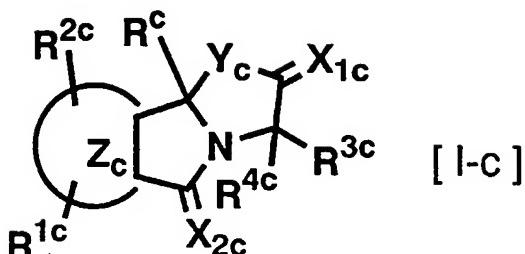
[式中、R^bは、アミノ基、カルバモイル基、カルボキシル基、ニトロ基、ハロゲン原子、ヒドロキシ基、アラルキルカルボニル基、N-アラルキルカルバモイル基、アリール基、アロイル基、C₂-C₆アルカノイル基、N-C₁-C₆アルキルアミノ基、N-C₁-C₁₀アルキルカルバモイル基、N-C₁-C₁₀アルキルチオカルバモイル基、N, N-ジ-C₁-C₁₀アルキルカルバモイル基、N, N-ジ-C₁-C₁₀アルキルチオカルバモイル基、N-C₂-C₆アルケニルカルバモイル基、N-N-C₁-C₁₀アルキルカルバモイル基、N-C₁-C₆アルコキシ-C₁-C₁₀アルキルカルバモイル基、N-C₁-C₆アルコキシカルボニル-C₁-C₁₀アルキルカルバモイル基、C₁-C₆アルコキシ基、アミノ-C₁-C₆アルコキシカルボニル基、N-C₃-C₆シクロアルキルアミノ基、N, N-ジ-C₃-C₆シクロアルキルアミノ基、C₃-C₆シクロアルキルオキシ基、N-C₃-C₆シクロアルキルカルバモイル基及びN, N-ジ-C₃-C₆シクロアルキルカルバモイル基からなる群より選択される置換基、チエニル基、ピリジル基、ピラジニル基、ピリミジニル基、フリル基、テトラヒドロフラニル基及びモルホリノ基からなる群より選択される5又は6員のヘテロ環基、エチレンジオキシフェニル基、ジベンゾフラニル基、ジベンゾチオフェニル基及びメチレンジオキシフェニル基からなる群より選択される窒素原子、酸素原子及び硫黄原子からなる群より選ばれるヘテロ原子を1環系当たり1ないし5個有する1ないし3環性の複素芳香環基並びに該ヘテロ環基又は該複素芳香環基が置換した、N-C₁-C₁₀アルキルカルバモイル基、N-C₁-C₁₀アルキルチオカルバモイル基、チオカルボニル基並びにカルボニル基からなる群から選択される置換基並びに該置換基で置換されていてもよい、直鎖の飽和C

$C_1 - C_9$ 脂肪族基、直鎖の不飽和 $C_1 - C_9$ 脂肪族基、分枝鎖の飽和 $C_1 - C_9$ 脂肪族基、分枝鎖の不飽和の $C_1 - C_9$ 脂肪族基及び $C_1 - C_6$ アルコキシ基からなる群より選択される置換基からなる群より選択される置換基を1又はそれ以上有してもよい、アリール基、アンスリル基及びフェナンスリル基からなる群より選択される1ないし3環性の $C_7 - C_{15}$ 炭素芳香環基又はチエニル基、ピリジル基、ピラジニル基、ピリミジニル基、フリル基、テトラヒドロフラニル基及びモルホリノ基からなる群より選択される5又は6員のヘテロ環基若しくはエチレンジオキシフェニル基、ジベンゾフラニル基、ジベンゾチオフェニル基及びメチレンジオキシフェニル基からなる群より選択される窒素原子、酸素原子及び硫黄原子からなる群より選ばれるヘテロ原子を1環系当たり1ないし5個有する1ないし3環性の複素芳香環基、 R^{1b} 及び R^{2b} は、同一又は異なって、水素原子、アミノ基、ニトロ基、ハロゲン原子、ヒドロキシ基、アリール基、N-アリールアミノ基、 $N-C_1-C_6$ アルキルアミノ基、 $N-N-C_1-C_6$ アルキルアミノ基、 $N-C_1-C_{10}$ アルキルカルバモイル基、 C_1-C_6 アルコキシ基、 C_1-C_6 アルコキシカルボニル基及び $N-C_3-C_6$ シクロアルキルアミノ基から選択される置換基又は該置換基で置換されていてもよい、直鎖の飽和 $C_1 - C_9$ 脂肪族基、直鎖の不飽和 $C_1 - C_9$ 脂肪族基、分枝鎖の飽和 $C_1 - C_9$ 脂肪族基、分枝鎖の不飽和の $C_1 - C_9$ 脂肪族基若しくは $C_1 - C_6$ アルコキシ基、 R^{3b} 及び R^{4b} は、同一又は異なって、水素原子、アジド基、アミジノ基、アミノ基、カルバモイル基、カルボキシル基、グアニジノ基、シアノ基、スルファモイル基、スルホ基、ニトロ基、ハロゲン原子、ヒドロキシ基、ホルミル基、環状の飽和 $C_3 - C_9$ 脂肪族基、環状の不飽和 $C_3 - C_9$ 脂肪族基、 $N-C_1-C_6$ アルキルアミノ基、 $N-C_1-C_{10}$ アルキルカルバモイル基、 C_1-C_6 アルキルチオ基及び C_1-C_6 アルコキシ基、 C_1-C_6 アルコキシカルボニル基からなる群から選択される置換基、該置換基で置換されていてもよい、直鎖の飽和 $C_1 - C_9$ 脂肪族基、直鎖の不飽和 $C_1 - C_9$ 脂肪族基、分枝鎖の飽和 $C_1 - C_9$ 脂肪族基及び分枝鎖の不飽和の $C_1 - C_9$ 脂肪族基からなる群から選択される置換基、アミノ基、カルバモイル基、カルボキシル基、ニトロ基、ハロゲン原子、ヒドロキシ基、アラルキルカルボニル基、 $N-アラルキルカルバモイル基$ 、アリール基、アロイル基、 C_2-C_6 アルカノイ

ル基、N—C₁—C₆アルキルアミノ基、N—C₁—C₁₀アルキルカルバモイル基、N—C₁—C₁₀アルキルチオカルバモイル基、N, N—ジー—C₁—C₁₀アルキルカルバモイル基、N, N—ジー—C₁—C₁₀アルキルチオカルバモイル基、N—C₂—C₆アルケニルカルバモイル基、N, N—ジー—C₂—C₆アルケニルカルバモイル基、N—アミノC₁—C₁₀アルキルカルバモイル基、N—C₁—C₆アルコキシC₁—C₁₀アルキルカルバモイル基、N—C₁—C₆アルコキシカルボニルC₁—C₁₀アルキルカルバモイル基、C₁—C₆アルコキシ基、アミノC₁—C₆アルコキシカルボニル基、N—C₃—C₆シクロアルキルアミノ基、N, N—ジー—C₃—C₆シクロアルキルアミノ基、C₃—C₆シクロアルキルオキシ基、N—C₃—C₆シクロアルキルカルバモイル基及びN, N—ジー—C₃—C₆シクロアルキルカルバモイル基からなる群より選択される置換基、チエニル基、ピリジル基、ピラジニル基、ピリミジニル基、フリル基、テトラヒドロフラニル基及びモルホリノ基からなる群より選択される5又は6員のヘテロ環基、エチレンジオキシフェニル基、ジベンゾフラニル基、ジベンゾチオフェニル基及びメチレンジオキシフェニル基からなる群より選択される窒素原子、酸素原子及び硫黄原子からなる群より選ばれるヘテロ原子を1環系当たり1ないし5個有する1ないし3環性の複素芳香環基並びに該ヘテロ環基又は該複素芳香環基が置換した、N—C₁—C₁₀アルキルカルバモイル基、N—C₁—C₁₀アルキルチオカルバモイル基、チオカルボニル基並びにカルボニル基からなる群から選択される置換基並びに該置換基で置換されていてもよい、直鎖の飽和C₁—C₉脂肪族基、直鎖の不飽和C₁—C₉脂肪族基、分枝鎖の飽和C₁—C₉脂肪族基、分枝鎖の不飽和のC₁—C₉脂肪族基及びC₁—C₆アルコキシ基からなる群より選択される置換基からなる群より選択される置換基を1又はそれ以上有していてもよい、アリール基、アンスリル基及びフェナントスリル基からなる群より選択される1ないし3環性のC₇—C₁₅炭素芳香環基又はチエニル基、ピリジル基、ピラジニル基、ピリミジニル基、フリル基、テトラヒドロフラニル基及びモルホリノ基からなる群より選択される5又は6員のヘテロ環基若しくはエチレンジオキシフェニル基、ジベンゾフラニル基、ジベンゾチオフェニル基及びメチレンジオキシフェニル基からなる群より選択される窒素原子、酸素原子及び硫黄原子からなる群より選ばれるヘテロ原子を1環系当たり

1ないし5個有する1ないし3環性の複素芳香環基又は該アリール基、該炭素芳香環基、該ヘテロ環基若しくは該複素芳香環基で置換されていてもよい、直鎖の飽和C₁—C₉脂肪族基、直鎖の不飽和C₁—C₉脂肪族基、分枝鎖の飽和C₁—C₉脂肪族基若しくは分枝鎖の不飽和のC₁—C₉脂肪族基を示すか、又はR^{3b}及びR^{4b}は、一緒になって、直鎖の不飽和C₁—C₉脂肪族基又は5若しくは6員の飽和炭素環基を形成し、X_{1b}は、酸素原子又は基：NR^{5b}（ここにおいて、R^{5b}は、水素原子、ヒドロキシ基、C₁—C₆アルコキシ基、C₁—C₆アルコキシカルボニル基及びN—C₁—C₁₀アルキルカルバモイル基からなる群から選択される置換基又は該置換基で置換されていてもよい、直鎖の飽和C₁—C₉脂肪族基、直鎖の不飽和C₁—C₉脂肪族基、分枝鎖の飽和C₁—C₉脂肪族基若しくは分枝鎖の不飽和のC₁—C₉脂肪族基を示す）、X_{2b}は、酸素原子又は硫黄原子、Y_bは、酸素原子、硫黄原子又は基：CR^{6b}R^{7b}（ここにおいて、R^{6b}は、水素原子、ヒドロキシ基、C₁—C₆アルコキシ基、C₁—C₆アルコキシカルボニル基及びN—C₁—C₁₀アルキルカルバモイル基からなる群から選択される置換基又は該置換基で置換されていてもよい、直鎖の飽和C₁—C₉脂肪族基、直鎖の不飽和C₁—C₉脂肪族基、分枝鎖の飽和C₁—C₉脂肪族基若しくは分枝鎖の不飽和のC₁—C₉脂肪族基、R^{7b}は、水素原子又はC₁—C₆アルキル基を示す）、Z_bは、縮合アリール基、アンスリル基、C₆—C₈シクロアルカニル基、C₆—C₈シクロアルカジエニル基及びC₆—C₈シクロアルケニル基からなる群より選択される2ないし3環性の飽和若しくは不飽和のC₆—C₁₅縮合炭素環基又はエチレンジオキシフェニル基、ピリジル基、ピラジニル基、ピリミジニル基、ピリダジニル基及びメチレンジオキシフェニル基からなる群より選択される6員のヘテロ環基若しくは窒素原子、酸素原子及び硫黄原子からなる群より選ばれるヘテロ原子を1環系当たり1ないし5個有する2ないし3環性の縮合複素芳香環基を示す]で表される化合物が好適である。

また、一般式



- [式中、R^cは、置換基を有していてもよい、アリール基、1ないし3環性のC₁—C₁₅炭素芳香環基（但し、アリール基を除く。）又は5若しくは6員のヘテロ環基若しくは窒素原子、酸素原子及び硫黄原子からなる群より選ばれるヘテロ原子を1環系当たり1ないし5個有する1ないし3環性の複素芳香環基（但し、5又は6員のヘテロ環基を除く。）、R^{1c}及びR^{2c}は、同一又は異なって、水素原子、アジド基、アミノ基、カルバモイル基、カルバモイルアミノ基、カルバモイルオキシ基、カルボキシル基、シアノ基、スルファモイル基、スルホ基、ニトロ基、ハロゲン原子、ヒドロキシ基、ホルミル基、ホルミルアミノ基、環状の飽和若しくは不飽和のC₃—C₉脂肪族基、アラルキル基、N—アラルキルアミノ基、アラルキルオキシ基、アラルキルカルボニル基、アリール基、N—アリールアミノ基、アリールオキシ基、アリールスルホニル基、N—アリールスルホニルアミノ基、N—アリールスルホニルアミノC₁—C₆アルキルアミノ基、N—アリールスルホニルアミノC₁—C₁₀アルキルカルバモイル基、アリールスルホニルアミノC₁—C₆アルコキシカルボニル基、C₂—C₆アルカノイル基、N—C₂—C₆アルカノイルアミノ基、アロイル基、N—アロイルアミノ基、N—アロイルC₁—C₆アルキルアミノ基、N—アロイルC₁—C₁₀アルキルカルバモイル基、N—C₁—C₆アルキルアミノ基、N—N—ジ—C₁—C₆アルキルアミノ基、N—C₁—C₁₀アルキルカルバモイル基、N—N—ジ—C₁—C₁₀アルキルカルバモイル基、N—C₁—C₆アルキルスルファモイル基、C₁—C₆アルキルスルフィニル基、C₁—C₆アルキルスルホニル基、C₁—C₆アルキルチオ基、C₁—C₆アルコキシ基、C₁—C₆アルコキシカルボニル基、N—C₃—C₆シクロアルキルアミノ基、C₃—C₆シクロアルキルオキシ基及びN—C₃—C₆シクロアルキルカルバモイル基からなる群から選択される置換基又は該置換基で置換されていてもよい、直鎖若しくは分枝鎖の飽和若しくは不飽和のC₁—C₉脂肪族基、N—C₁—C₆アルキルア

ミノ基、 $C_1 - C_6$ アルキルチオ基若しくは $C_1 - C_6$ アルコキシ基、 R^{3c} 及び R^{4c} は、同一又は異なって、水素原子、アジド基、アミジノ基、アミノ基、カルバモイル基、カルバモイルアミノ基、カルバモイルオキシ基、カルボキシル基、グアニジノ基、シアノ基、スルファモイル基、スルホ基、ニトロ基、ハロゲン原子、

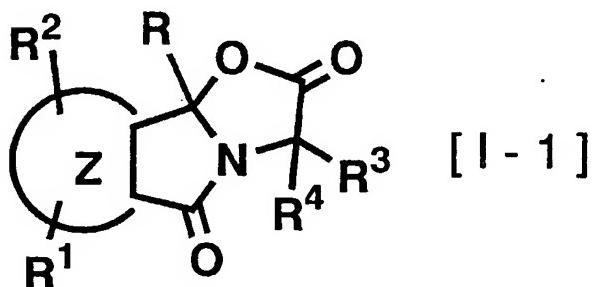
5 ヒドロキシ基、ホルミル基、ホルミルアミノ基、環状の飽和若しくは不飽和の $C_3 - C_9$ 脂肪族基、 $C_2 - C_6$ アルカノイル基、 $N - C_2 - C_6$ アルカノイルアミノ基、 $N - C_1 - C_6$ アルキルアミノ基、 N, N -ジ- $C_1 - C_6$ アルキルアミノ基、 $N - C_1 - C_{10}$ アルキルカルバモイル基、 N, N -ジ- $C_1 - C_{10}$ アルキルカルバモイル基、 $C_1 - C_6$ アルキルチオ基、 $N - C_1 - C_6$ アルキルスルファモイル基、 C

10 $_1 - C_6$ アルキルスルフィニル基、 $C_1 - C_6$ アルキルスルホニル基、 $C_1 - C_6$ アルコキシ基、 $C_1 - C_6$ アルコキシカルボニル基、 $N - C_3 - C_6$ シクロアルキルアミノ基、 $C_3 - C_6$ シクロアルキルオキシ基及び $N - C_3 - C_6$ シクロアルキルカルバモイル基からなる群から選択される置換基、該置換基で置換されていてもよい、直鎖若しくは分枝鎖の飽和若しくは不飽和の $C_1 - C_9$ 脂肪族基、置換基を有してもよい、アリール基、1ないし3環性の $C_7 - C_{15}$ 炭素芳香環基（但し、アリール基を除く。）、5若しくは6員のヘテロ環基若しくは窒素原子、酸素原子及び硫黄原子からなる群より選ばれるヘテロ原子を1環系当たり1ないし5個有する1ないし3環性の複素芳香環基（但し、5又は6員のヘテロ環基を除く。）又は該アリール基、該炭素芳香環基、該ヘテロ環基若しくは該複素芳香環基で置換されていてもよい、直鎖若しくは分枝鎖の飽和若しくは不飽和の $C_1 - C_9$ 脂肪族基を示すか、又は R^{3c} 及び R^{4c} は、一緒になって、直鎖若しくは分枝鎖の不飽和の $C_1 - C_9$ 脂肪族基又は5若しくは6員の飽和若しくは不飽和の炭素環を形成し、 X_{1c} 及び X_{2c} は、同一又は異なって、酸素原子又は硫黄原子、 Y_c は、酸素原子、硫黄原子又は基： CHR^{5c} 若しくは基： NR^{5c} （ここにおいて、 R^{5c} は水素原子、ハロゲン原子、ヒドロキシ基、 $C_1 - C_6$ アルコキシ基、 $C_2 - C_6$ アルカノイル基、カルバモイル基及び $N - C_1 - C_{10}$ アルキルカルバモイル基からなる群から選択される置換基又は該置換基で置換されていてもよい、直鎖若しくは分枝鎖の飽和若しくは不飽和の $C_1 - C_9$ 脂肪族基を示す）、 Z_c は、縮合アリール基、2ないし3環性の飽和若しくは不飽和の $C_6 - C_{15}$ 縮合炭素環基（但

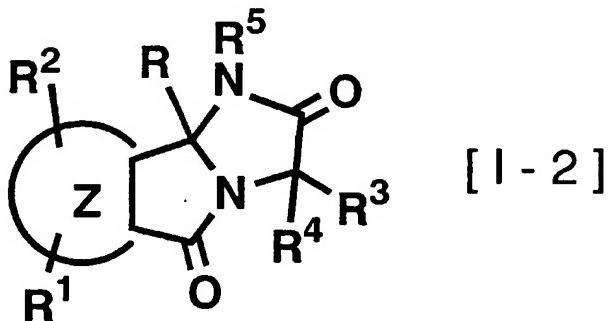
し、縮合アリール基を除く。) 又は 6 員のヘテロ環基若しくは窒素原子、酸素原子及び硫黄原子からなる群より選ばれるヘテロ原子を 1 環系当たり 1 ないし 5 個有する 2 ないし 3 環性の縮合複素芳香環基 (但し、6 員のヘテロ環基を除く。) を示す] で表される化合物は、本願の優先権の基礎出願に記載の化合物であり、

- 5 本発明の一般式 [I] の化合物に包含される。

また、一般式 [I] の化合物は、一般式 [I - 1]

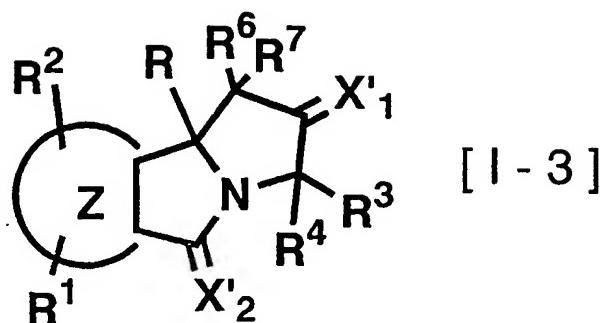


[式中、R、R¹、R²、R³、R⁴及びZは前記の意味を有する] で表される化合物、一般式 [I - 2]

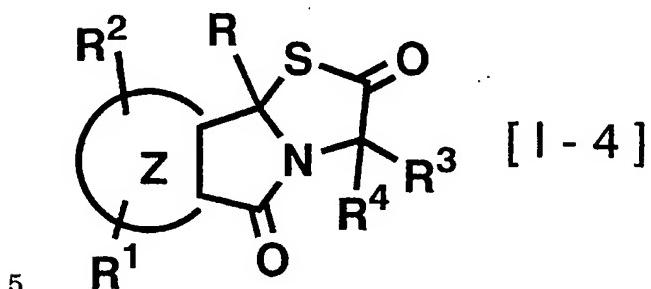


10

[式中、R、R¹、R²、R³、R⁴、R⁵及びZは前記の意味を有する] で表される化合物、一般式 [I - 3]



[式中、X'₁は、酸素原子又は基：N（R⁵）、X'₂は、酸素原子又は硫黄原子を示し、R、R¹、R²、R³、R⁴、R⁵、R⁶、R⁷及びZは前記の意味を有する。]で表される化合物及び一般式 [I - 4]

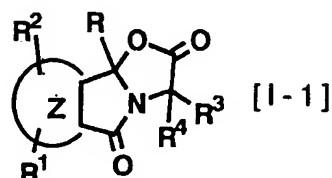


5

[式中、R、R¹、R²、R³、R⁴及びZは前記の意味を有する。]で表される化合物からなり、これらの化合物中、好適な化合物群は、一般式 [I - 1] の化合物、一般式 [I - 3] の化合物及び一般式 [I - 4] の化合物であり、中でも一般式 [I - 1] の化合物及び一般式 [I - 3] の化合物が好適である。

以下に、本発明の一般式 [I] の化合物の代表例を表1ないし表45に示す。

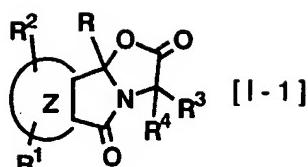
(表1)



| 化合物例 | R ¹ | R ² | R ³ | R ⁴ | Z | R |
|------|----------------|----------------|----------------|----------------|----|---|
| 1001 | H | H | i-Pr | H | Ph | 2-MeO-Ph |
| 1002 | H | H | i-Pr | H | Ph | Ph |
| 1003 | H | H | i-Pr | H | Ph | 2-NH ₂ -Ph |
| 1004 | H | H | i-Pr | H | Ph | 4-F-Ph |
| 1005 | H | H | i-Pr | H | Ph | 4-Et ₂ N-Ph |
| 1006 | H | H | i-Pr | H | Ph | 4-Cl-Ph |
| 1007 | H | H | i-Pr | H | Ph | 4-HO-Ph |
| 1008 | H | H | i-Pr | H | Ph | 3-MeO-Ph |
| 1009 | H | H | i-Pr | H | Ph | 3-HO-Ph |
| 1010 | H | H | i-Pr | H | Ph | 3-NH ₂ -Ph |
| 1011 | H | H | i-Pr | H | Ph | 4-MeO-Ph |
| 1012 | H | H | i-Pr | H | Ph | 4-Me-Ph |
| 1013 | H | H | i-Pr | H | Ph | 3-Me-Ph |
| 1014 | H | H | i-Pr | H | Ph | 4-tBuO ₂ CCH ₂ O-Ph |
| 1015 | H | H | i-Pr | H | Ph | 4-HO ₂ CCH ₂ O-Ph |
| 1016 | H | H | i-Pr | H | Ph | 4-tBuO ₂ C(CH ₂) ₅ O-Ph |
| 1017 | H | H | i-Pr | H | Ph | 4-HO ₂ C(CH ₂) ₅ O-Ph |
| 1018 | H | H | i-Pr | H | Ph | 4-HO(CH ₂) ₃ O-Ph |
| 1019 | H | H | i-Pr | H | Ph | 4-HO(CH ₂) ₂ O-Ph |
| 1020 | H | H | i-Pr | H | Ph | 4-HOC(Me) ₂ (CH ₂) ₂ O-Ph |
| 1021 | H | H | i-Pr | H | Ph | 4-PhCH ₂ O-Ph |
| 1022 | H | H | i-Pr | H | Ph | 4-MeNHCOCH ₂ O-Ph |
| 1023 | H | H | i-Pr | H | Ph | 4-EtNHCOCH ₂ O-Ph |

| | | | | | | |
|------|---|---|------|---|----|---|
| 1024 | H | H | i-Pr | H | Ph | 4-nPrNHCOCH ₂ O-Ph |
| 1025 | H | H | i-Pr | H | Ph | 4-nBuNHCOCH ₂ O-Ph |
| 1026 | H | H | i-Pr | H | Ph | 4-CH ₂ =CHCH ₂ NHCOCH ₂ O-Ph |
| 1027 | H | H | i-Pr | H | Ph | 4-Me(CH ₂) ₉ NHCOCH ₂ O-Ph |
| 1028 | H | H | i-Pr | H | Ph | 4-N ₃ (CH ₂) ₃ O-Ph |
| 1029 | H | H | i-Pr | H | Ph | 4-tBuO ₂ CCH(Me)O-Ph |
| 1030 | H | H | i-Pr | H | Ph | 4-nPrNHCOCH(Me)O-Ph |
| 1031 | H | H | i-Pr | H | Ph | 4-F ₃ CSO ₃ -Ph |
| 1032 | H | H | i-Pr | H | Ph | 4-tBuO ₂ CCH=CHPh |
| 1033 | H | H | i-Pr | H | Ph | 4-nPrNHCOCH=CH-Ph |
| 1034 | H | H | i-Pr | H | Ph | 4-nPrCH(Me)NHCOCH ₂ O-Ph |
| 1035 | H | H | i-Pr | H | Ph | 4-EtCH(Me)NHCOCH ₂ O-Ph |
| 1036 | H | H | i-Pr | H | Ph | 4-MeOCH ₂ O-Ph |
| 1037 | H | H | i-Pr | H | Ph | 4-EtCOCH ₂ O-Ph |
| 1038 | H | H | i-Pr | H | Ph | 3-tBuO ₂ CCH ₂ O-Ph |
| 1039 | H | H | i-Pr | H | Ph | 3-HO ₂ CCH ₂ O-Ph |
| 1040 | H | H | i-Pr | H | Ph | 3-nPrNHCOCH ₂ O-Ph |
| 1041 | H | H | i-Pr | H | Ph | 4-H ₂ NC(Me) ₂ CH ₂ O ₂ CCH ₂ O-Ph |
| 1042 | H | H | i-Pr | H | Ph | 4-morpholinoCOCH ₂ O-Ph |
| 1043 | H | H | i-Pr | H | Ph | 4-(4-Cl-Ph)-COCH ₂ O-Ph |
| 1044 | H | H | i-Pr | H | Ph | 4-PhCOCH ₂ O-Ph |
| 1045 | H | H | i-Pr | H | Ph | 4-(4-pyridyl)-CH ₂ NHCOCH ₂ O-Ph |
| 1046 | H | H | i-Pr | H | Ph | 4-H ₂ NCH ₂ CH ₂ NHCOCH ₂ O-Ph |

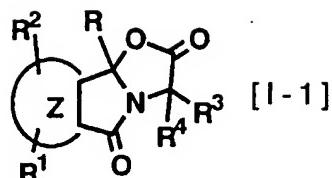
(表2)



| 化合物例 | R ¹ | R ² | R ³ | R ⁴ | Z | R |
|------|----------------|----------------|----------------|----------------|----|---|
| 1047 | H | H | i-Pr | H | Ph | 4-Cl-3-NO ₂ -Ph |
| 1048 | H | H | i-Pr | H | Ph | 4-Cl-3-F-Ph |
| 1049 | H | H | i-Pr | H | Ph | 4-Cl-3-Me-Ph |
| 1050 | H | H | i-Pr | H | Ph | 3-NH ₂ -4-Cl-Ph |
| 1051 | H | H | i-Pr | H | Ph | 3-Cl-4-MeO-Ph |
| 1052 | H | H | i-Pr | H | Ph | 3-Cl-4-Me-Ph |
| 1053 | H | H | i-Pr | H | Ph | 4-Br-3-Cl-Ph |
| 1054 | H | H | i-Pr | H | Ph | 4-Br-2-Cl-Ph |
| 1055 | H | H | i-Pr | H | Ph | 4-F-3-Me-Ph |
| 1056 | H | H | i-Pr | H | Ph | 3-F-4-Me-Ph |
| 1057 | H | H | i-Pr | H | Ph | 3-Br-4-HO-Ph |
| 1058 | H | H | i-Pr | H | Ph | 3-Br-4-MeO-Ph |
| 1059 | H | H | i-Pr | H | Ph | 3-Br-4-F-Ph |
| 1060 | H | H | i-Pr | H | Ph | 3-F-4-PhPh |
| 1061 | H | H | i-Pr | H | Ph | 4-HO-3-I-Ph |
| 1062 | H | H | i-Pr | H | Ph | 5-HO-2-I-Ph |
| 1063 | H | H | i-Pr | H | Ph | 3-I-4-MeO-Ph |
| 1064 | H | H | i-Pr | H | Ph | 2-I-5-MeO-Ph |
| 1065 | H | H | i-Pr | H | Ph | 4-MeO-3-Me-Ph |
| 1066 | H | H | i-Pr | H | Ph | 4-HO(CH ₂) ₃ O-3-I-Ph |
| 1067 | H | H | i-Pr | H | Ph | 4-HO(CH ₂) ₂ O-3-I-Ph |
| 1068 | H | H | i-Pr | H | Ph | 4-HOC(Me) ₂ (CH ₂) ₂ O-3-I-Ph |
| 1069 | H | H | i-Pr | H | Ph | 4-tBuO ₂ C(CH ₂) ₄ O-3-I-Ph |

| | | | | | | |
|------|---|---|------|---|----|---|
| 1070 | H | H | i-Pr | H | Ph | 3-I-4-PhCH ₂ O-Ph |
| 1071 | H | H | i-Pr | H | Ph | 4-H ₂ NCOCH ₂ O-3-I-Ph |
| 1072 | H | H | i-Pr | H | Ph | 3-I-4-MeNHCOCH ₂ O-Ph |
| 1073 | H | H | i-Pr | H | Ph | 4-EtNHCOCH ₂ O-3-I-Ph |
| 1074 | H | H | i-Pr | H | Ph | 3-I-4-nPrNHCOCH ₂ O-Ph |
| 1075 | H | H | i-Pr | H | Ph | 3-I-4-iPrNHCOCH ₂ O-Ph |
| 1076 | H | H | i-Pr | H | Ph | 4-nBuNHCOCH ₂ O-3-I-Ph |
| 1077 | H | H | i-Pr | H | Ph | 4-tBuNHCOCH ₂ O-3-I-Ph |
| 1078 | H | H | i-Pr | H | Ph | 4-iBuNHCOCH ₂ O-Ph |
| 1079 | H | H | i-Pr | H | Ph | 4-tBuO ₂ CCH ₂ O-3-I-Ph |
| 1080 | H | H | i-Pr | H | Ph | 3-I-4-PhCH ₂ NHCOCH ₂ O-Ph |
| 1081 | H | H | i-Pr | H | Ph | 3-I-4-(2-tetrahydrofuryl)CH ₂ NHCOCH ₂ O-Ph |
| 1082 | H | H | i-Pr | H | Ph | 4-cycloPrNHCOCH ₂ O-3-I-Ph |
| 1083 | H | H | i-Pr | H | Ph | 4-cycloPentyNHCOCH ₂ O-3-I-Ph |
| 1084 | H | H | i-Pr | H | Ph | 4-cycloHexylNHCOCH ₂ O-3-I-Ph |
| 1085 | H | H | i-Pr | H | Ph | 4-cycloPrNHCOCH ₂ O-3-F-Ph |
| 1086 | H | H | i-Pr | H | Ph | 4-Me(CH ₂) ₉ NHCOCH ₂ O-3-I-Ph |
| 1087 | H | H | i-Pr | H | Ph | 4-HO ₂ CCH ₂ O-3-I-Ph |
| 1088 | H | H | i-Pr | H | Ph | 4-N ₃ (CH ₂) ₃ O-3-I-Ph |
| 1089 | H | H | i-Pr | H | Ph | 3-I-4-nPrNHC(O(CH ₂) ₄ O-Ph |
| 1090 | H | H | i-Pr | H | Ph | 4-Et ₂ NCOCH ₂ O-3-I-Ph |
| 1091 | H | H | i-Pr | H | Ph | 3-I-4-nPrN(Me)COCH ₂ O-Ph |
| 1092 | H | H | i-Pr | H | Ph | 3-Cl-4-nPrNHCOCH ₂ O-Ph |

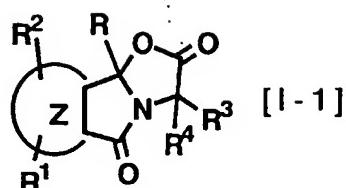
(表3)



| 化合物例 | R ¹ | R ² | R ³ | R ⁴ | Z | R |
|------|----------------|----------------|----------------|----------------|----|--|
| 1093 | H | H | i-Pr | H | Ph | 3-Br-4-nPrNHCOCH ₂ O-Ph |
| 1094 | H | H | i-Pr | H | Ph | 3-F-4-nPrNHCOCH ₂ O-Ph |
| 1095 | H | H | i-Pr | H | Ph | 3-Me-4-nPrNHCOCH ₂ O-Ph |
| 1096 | H | H | i-Pr | H | Ph | 4-EtNHCOCH ₂ O-3-F-Ph |
| 1097 | H | H | i-Pr | H | Ph | 3-I-4-iPrNHCOC(Me) ₂ CH ₂ O-Ph |
| 1098 | H | H | i-Pr | H | Ph | 3-Br-4-CH ₂ =CHCH ₂ NHCOCH ₂ O-Ph |
| 1099 | H | H | i-Pr | H | Ph | 4-iBuNHCOCH ₂ O-3-F-Ph |
| 1100 | H | H | i-Pr | H | Ph | 3-tBuO ₂ CCH=CH-4-nPrNHCOCH ₂ O-Ph |
| 1101 | H | H | i-Pr | H | Ph | 3-HO ₂ CCH=CH-4-nPrNHCOCH ₂ O-Ph |
| 1102 | H | H | i-Pr | H | Ph | 3-I-4-MeOCH ₂ CH ₂ NHCOCH ₂ O-Ph |
| 1103 | H | H | i-Pr | H | Ph | 3-F-4-HO-Ph |
| 1104 | H | H | i-Pr | H | Ph | 3-F-4-MeO-Ph |
| 1105 | H | H | i-Pr | H | Ph | 3,4-methylenedioxyPh |
| 1106 | H | H | i-Pr | H | Ph | 3,4-ethylenedioxyPh |
| 1107 | H | H | i-Pr | H | Ph | 3,4-Cl ₂ -Ph |
| 1108 | H | H | i-Pr | H | Ph | 3,4-Me ₂ -Ph |
| 1109 | H | H | i-Pr | H | Ph | 3,4-F ₂ -Ph |
| 1110 | H | H | i-Pr | H | Ph | 3,4-(MeO) ₂ -Ph |
| 1111 | H | H | i-Pr | H | Ph | 3,5-(MeO) ₂ -Ph |
| 1112 | H | H | i-Pr | H | Ph | 3,5-Me ₂ -Ph |
| 1113 | H | H | i-Pr | H | Ph | 3,5-I ₂ -4-HO-Ph |
| 1114 | H | H | i-Pr | H | Ph | 2,4-I ₂ -5-HO-Ph |
| 1115 | H | H | i-Pr | H | Ph | 3,5-I ₂ -4-MeO-Ph |
| 1116 | H | H | i-Pr | H | Ph | 2,4-I ₂ -5-MeO-Ph |

| | | | | | | |
|------|---------------------|---|------|---|----|---|
| 1117 | H | H | i-Pr | H | Ph | 2,4,6-Me ₃ -Ph |
| 1118 | H | H | i-Pr | H | Ph | 4-HO(CH ₂) ₃ O-3,5-I ₂ Ph |
| 1119 | H | H | i-Pr | H | Ph | 3,5-I ₂ -4-nPrNHCOCH ₂ O-Ph |
| 1120 | H | H | i-Pr | H | Ph | 2-thienyl |
| 1121 | H | H | i-Pr | H | Ph | 2-furyl |
| 1122 | H | H | i-Pr | H | Ph | 3-pyridyl |
| 1123 | H | H | i-Pr | H | Ph | 2-naphthyl |
| 1124 | H | H | i-Pr | H | Ph | 5-F-1-naphthyl |
| 1125 | H | H | i-Pr | H | Ph | dibenzothiophene-2-yl |
| 1126 | 6-F | H | i-Pr | H | Ph | Ph |
| 1127 | 7-F | H | i-Pr | H | Ph | Ph |
| 1128 | 8-F | H | i-Pr | H | Ph | Ph |
| 1129 | 9-F | H | i-Pr | H | Ph | Ph |
| 1130 | 6-MeO | H | i-Pr | H | Ph | Ph |
| 1131 | 9-MeO | H | i-Pr | H | Ph | Ph |
| 1132 | 6-OH | H | i-Pr | H | Ph | Ph |
| 1133 | 9-OH | H | i-Pr | H | Ph | Ph |
| 1134 | 7-NO ₂ | H | i-Pr | H | Ph | Ph |
| 1135 | 8-NO ₂ | H | i-Pr | H | Ph | Ph |
| 1136 | 9-NO ₂ | H | i-Pr | H | Ph | Ph |
| 1137 | 6-NHPh | H | i-Pr | H | Ph | Ph |
| 1138 | 7-Me ₂ N | H | i-Pr | H | Ph | Ph |

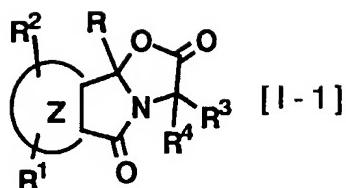
(表4)



| 化合物例 | R ¹ | R ² | R ³ | R ⁴ | Z | R |
|------|----------------|----------------|----------------|----------------|--------------|----|
| 1139 | 7-Me | H | i-Pr | H | Ph | Ph |
| 1140 | 8-Me | H | i-Pr | H | Ph | Ph |
| 1141 | 7-t-Bu | H | i-Pr | H | Ph | Ph |
| 1142 | 8-t-Bu | H | i-Pr | H | Ph | Ph |
| 1143 | 7-Br | H | i-Pr | H | Ph | Ph |
| 1144 | 8-Br | H | i-Pr | H | Ph | Ph |
| 1145 | 7-Cl | H | i-Pr | H | Ph | Ph |
| 1146 | 8-Cl | H | i-Pr | H | Ph | Ph |
| 1147 | 7-Cl | 8-Cl | i-Pr | H | Ph | Ph |
| 1148 | 6-Cl | 9-Cl | i-Pr | H | Ph | Ph |
| 1149 | 6-OH | 9-I | i-Pr | H | Ph | Ph |
| 1150 | H | H | i-Pr | H | 1,2-naphthyl | Ph |
| 1151 | H | H | i-Pr | H | 2,3-naphthyl | Ph |
| 1152 | H | H | i-Pr | H | cyclohexenyl | Ph |
| 1153 | H | H | D-Leucine | H | Ph | Ph |
| 1154 | H | H | L-Leucine | H | Ph | Ph |
| 1155 | H | H | D-NorLeucine | H | Ph | Ph |
| 1156 | H | H | L-NorLeucine | H | Ph | Ph |
| 1157 | H | H | D-AlloLeucine | H | Ph | Ph |
| 1158 | H | H | L-AlloLeucine | H | Ph | Ph |
| 1159 | H | H | D-NorValine | H | Ph | Ph |
| 1160 | H | H | L-NorValine | H | Ph | Ph |
| 1161 | H | H | D-Alanine | H | Ph | Ph |

| | | | | | | |
|------|---|---|-----------------------|---|----|---------|
| 1162 | H | H | L-Alanine | H | Ph | Ph |
| 1163 | H | H | D-Arginine | H | Ph | Ph |
| 1164 | H | H | L-Arginine | H | Ph | Ph |
| 1165 | H | H | D-Asparagine | H | Ph | Ph |
| 1166 | H | H | L-Asparagine | H | Ph | Ph |
| 1167 | H | H | D-Glutamic Acid | H | Ph | Ph |
| 1168 | H | H | L-Glutamic Acid | H | Ph | Ph |
| 1169 | H | H | D-Glutamine | H | Ph | Ph |
| 1170 | H | H | L-Glutamine | H | Ph | Ph |
| 1171 | H | H | D-Histidine | H | Ph | Ph |
| 1172 | H | H | L-Histidine | H | Ph | Ph |
| 1173 | H | H | D-Methionine | H | Ph | Ph |
| 1174 | H | H | L-Methionine | H | Ph | Ph |
| 1175 | H | H | D-Tryptophan | H | Ph | Ph |
| 1176 | H | H | L-Tryptophan | H | Ph | Ph |
| 1177 | H | H | D-Tyrosine | H | Ph | Ph |
| 1178 | H | H | L-Tyrosine | H | Ph | Ph |
| 1179 | H | H | D- Homo Phenylalanine | H | Ph | Ph |
| 1180 | H | H | L- Homo Phenylalanine | H | Ph | Ph |
| 1181 | H | H | D-Leucine | H | Ph | 4-Cl-Ph |
| 1182 | H | H | L-Leucine | H | Ph | 4-Cl-Ph |
| 1183 | H | H | D- NorLeucine | H | Ph | 4-Cl-Ph |

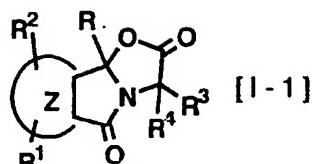
(表5)



| 化合物例 | R ¹ | R ² | R ³ | R ⁴ | Z | R |
|------|----------------|----------------|-----------------|----------------|----|---------|
| 1184 | H | H | L-NorLeucine | H | Ph | 4-Cl-Ph |
| 1185 | H | H | D-AlloLeucine | H | Ph | 4-Cl-Ph |
| 1186 | H | H | L-AlloLeucine | H | Ph | 4-Cl-Ph |
| 1187 | H | H | D-NorValine | H | Ph | 4-Cl-Ph |
| 1188 | H | H | L-NorValine | H | Ph | 4-Cl-Ph |
| 1189 | H | H | D-Alanine | H | Ph | 4-Cl-Ph |
| 1190 | H | H | L-Alanine | H | Ph | 4-Cl-Ph |
| 1191 | H | H | D-Arginine | H | Ph | 4-Cl-Ph |
| 1192 | H | H | L-Arginine | H | Ph | 4-Cl-Ph |
| 1193 | H | H | D-Asparagine | H | Ph | 4-Cl-Ph |
| 1194 | H | H | L-Asparagine | H | Ph | 4-Cl-Ph |
| 1195 | H | H | D-Glutamic Acid | H | Ph | 4-Cl-Ph |
| 1196 | H | H | L-Glutamic Acid | H | Ph | 4-Cl-Ph |
| 1197 | H | H | D-Glutamine | H | Ph | 4-Cl-Ph |
| 1198 | H | H | L-Glutamine | H | Ph | 4-Cl-Ph |
| 1199 | H | H | D-Histidine | H | Ph | 4-Cl-Ph |
| 1200 | H | H | L-Histidine | H | Ph | 4-Cl-Ph |
| 1201 | H | H | D-Methionine | H | Ph | 4-Cl-Ph |
| 1202 | H | H | L-Methionine | H | Ph | 4-Cl-Ph |
| 1203 | H | H | D-Tryptophan | H | Ph | 4-Cl-Ph |
| 1204 | H | H | L-Tryptophan | H | Ph | 4-Cl-Ph |
| 1205 | H | H | D-Tyrosine | H | Ph | 4-Cl-Ph |
| 1206 | H | H | L-Tyrosine | H | Ph | 4-Cl-Ph |

| | | | | | | |
|------|---|---|---|----|----|--|
| 1207 | H | H | D- Homo Phenylalanine | H | Ph | 4-Cl-Ph |
| 1208 | H | H | L- Homo Phenylalanine | H | Ph | 4-Cl-Ph |
| 1209 | H | H | t-Bu | H | Ph | Ph |
| 1210 | H | H | (CH ₃) ₂ (OH)C | H | Ph | Ph |
| 1211 | H | H | CH ₃ (MeO)CH | H | Ph | Ph |
| 1212 | H | H | 4-HO-Ph | H | Ph | Ph |
| 1213 | H | H | 4-HO-3-I-Ph | H | Ph | Ph |
| 1214 | H | H | 4-HO-3,5-I ₂ -Ph | H | Ph | Ph |
| 1215 | H | H | 4-HO-3-I-PhCH ₂ | H | Ph | Ph |
| 1216 | H | H | 4-HO-3,5-I ₂ -PhCH ₂ | H | Ph | Ph |
| 1217 | H | H | 1-naphthylmethyl | H | Ph | Ph |
| 1218 | H | H | 4-F-PhCH ₂ | H | Ph | Ph |
| 1219 | H | H | 1-naphthylmethyl | H | Ph | 4-Cl-Ph |
| 1220 | H | H | 4-F-PhCH ₂ | H | Ph | 4-Cl-Ph |
| 1221 | H | H | i-Pr | Me | Ph | 4-Cl-Ph |
| 1222 | H | H | Me | Me | Ph | Ph |
| 1223 | H | H | (R ⁴ と一緒になって)CH ₂ = | - | Ph | Ph |
| 1224 | H | H | (R ⁴ と一緒になって)MeCH= | - | Ph | Ph |
| 1225 | H | H | (R ⁴ と一緒になって)(CH ₂) ₄ | - | Ph | Ph |
| 1226 | H | H | i-Pr | H | Ph | 4-n-PrNHCOCH ₂ CH ₂ O-Ph |
| 1227 | H | H | i-Pr | H | Ph | 4-i-PrNHCOCH ₂ CH ₂ O-Ph |
| 1228 | H | H | i-Pr | H | Ph | 4-EtNHCOCH ₂ CH ₂ O-Ph |

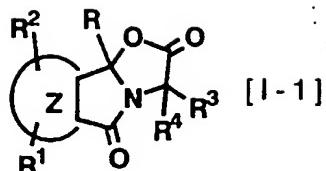
(表6)



| 化合物例 | R ¹ | R ² | R ² | R ³ | R ⁴ | R |
|------|----------------|----------------|----------------|----------------|----------------|--|
| 1229 | H | H | i-Pr | H | Ph | 4-EtCH(Me)NHCOCH ₂ CH ₂ O-Ph |
| 1230 | H | H | i-Pr | H | Ph | 3-Cl-4-i-PrNHCOCH ₂ O-Ph |
| 1231 | H | H | i-Pr | H | Ph | 3-Cl-4-EtNHCOCH ₂ O-Ph |
| 1232 | H | H | i-Pr | H | Ph | 3-Cl-4-EtCH(Me)NHCOCH ₂ O-Ph |
| 1233 | H | H | i-Pr | H | Ph | 4-i-PrNHCOCH ₂ O-3-Me-Ph |
| 1234 | H | H | i-Pr | H | Ph | 4-EtNHCOCH ₂ O-3-Me-Ph |
| 1235 | H | H | i-Pr | H | Ph | 4-EtCH(Me)NHCOCH ₂ O-3-Me-Ph |
| 1236 | H | H | i-Pr | H | Ph | 4-cycloPrNHCOCH ₂ CH ₂ O-Ph |
| 1237 | H | H | i-Pr | H | Ph | 4-cycloPentyNHCOCH ₂ CH ₂ O-Ph |
| 1238 | H | H | i-Pr | H | Ph | 3-I-4-n-PrNHCOCH ₂ CH ₂ O-Ph |
| 1239 | H | H | i-Pr | H | Ph | 3-I-4-i-PrNHCOCH ₂ CH ₂ O-Ph |
| 1240 | H | H | i-Pr | H | Ph | 4-EtNHCOCH ₂ CH ₂ O-3-I-Ph |
| 1241 | H | H | i-Pr | H | Ph | 4-EtCH(Me)NHCOCH ₂ CH ₂ O-3-I-Ph |
| 1242 | H | H | i-Pr | H | Ph | 4-EtCOCH ₂ CH ₂ O-3-I-Ph |
| 1243 | H | H | i-Pr | H | Ph | 4-cycloPrNHCOCH ₂ CH ₂ O-3-I-Ph |
| 1244 | H | H | i-Pr | H | Ph | 4-cycloPentyNHCOCH ₂ CH ₂ O-3-I-Ph |
| 1245 | H | H | i-Pr | H | Ph | 3-F-4-n-PrNHCOCH ₂ CH ₂ O-Ph |
| 1246 | H | H | i-Pr | H | Ph | 3-F-4-i-PrNHCOCH ₂ CH ₂ O-Ph |
| 1247 | H | H | i-Pr | H | Ph | 4-EtNHCOCH ₂ CH ₂ O-3-F-Ph |
| 1248 | H | H | i-Pr | H | Ph | 4-EtCH(Me)NHCOCH ₂ CH ₂ O-3-F-Ph |
| 1249 | H | H | i-Pr | H | Ph | 4-EtCOCH ₂ CH ₂ O-3-F-Ph |
| 1250 | H | H | i-Pr | H | Ph | 3-F-4-i-BuNHCOCH ₂ CH ₂ O-Ph |

| | | | | | | |
|------|---|---|------|---|----|--|
| 1251 | H | H | i-Pr | H | Ph | 4-cycloPrNHCOCH ₂ CH ₂ O-3-F-Ph |
| 1252 | H | H | i-Pr | H | Ph | 3-Br-4-n-PrNHCOCH ₂ CH ₂ O-Ph |
| 1253 | H | H | i-Pr | H | Ph | 3-Br-4-i-PrNHCOCH ₂ CH ₂ O-Ph |
| 1254 | H | H | i-Pr | H | Ph | 3-Br-4-EtNHCOCH ₂ CH ₂ O-Ph |
| 1255 | H | H | i-Pr | H | Ph | 3-Br-4-i-BuNHCOCH ₂ CH ₂ O-Ph |
| 1256 | H | H | i-Pr | H | Ph | 3-Cl-4-n-PrNHCOCH ₂ CH ₂ O-Ph |
| 1257 | H | H | i-Pr | H | Ph | 3-Cl-4-i-PrNHCOCH ₂ CH ₂ O-Ph |
| 1258 | H | H | i-Pr | H | Ph | 3-Cl-4-EtNHCOCH ₂ CH ₂ O-Ph |
| 1259 | H | H | i-Pr | H | Ph | 3-Cl-4-EtCH(Me)NHCOCH ₂ CH ₂ O-Ph |
| 1260 | H | H | i-Pr | H | Ph | 3-Cl-4-cycloPrNHCOCH ₂ CH ₂ O-Ph |
| 1261 | H | H | i-Pr | H | Ph | 3-Cl-4-cycloPentylNHCOCH ₂ CH ₂ O-Ph |
| 1262 | H | H | i-Pr | H | Ph | 3-Me-4-n-PrNHCOCH ₂ CH ₂ O-Ph |
| 1263 | H | H | i-Pr | H | Ph | 4-i-PrNHCOCH ₂ CH ₂ O-3-Me-Ph |
| 1264 | H | H | i-Pr | H | Ph | 4-EtNHCOCH ₂ CH ₂ O-3-Me-Ph |
| 1265 | H | H | i-Pr | H | Ph | 3-Me-4-MeNHCOCH ₂ CH ₂ O-Ph |
| 1266 | H | H | i-Pr | H | Ph | 3-Me-4-n-BuNHCOCH ₂ CH ₂ O-Ph |
| 1267 | H | H | i-Pr | H | Ph | 4-EtCH(Me)NHCOCH ₂ CH ₂ O-3-Me-Ph |
| 1268 | H | H | i-Pr | H | Ph | 4-EtCOCH ₂ CH ₂ O-3-Me-Ph |
| 1269 | H | H | i-Pr | H | Ph | 4-i-BuNHCOCH ₂ CH ₂ O-3-Me-Ph |
| 1270 | H | H | i-Pr | H | Ph | 3-Me-4-t-BuNHCOCH ₂ CH ₂ O-Ph |
| 1271 | H | H | i-Pr | H | Ph | 4-cycloPrNHCOCH ₂ CH ₂ O-3-Me-Ph |
| 1272 | H | H | i-Pr | H | Ph | 4-cycloPentylNHCOCH ₂ CH ₂ O-3-Me-Ph |
| 1273 | H | H | Me | H | Ph | 3-Cl-4-n-PrNHCOCH ₂ O-Ph |

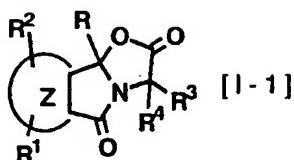
(表7)



| 化合物例 | R ¹ | R ² | R ³ | R ⁴ | Z | R |
|------|----------------|----------------|----------------|----------------|----|---|
| 1274 | H | H | Me | H | Ph | 3-Cl-4-i-PrNHCOCH ₂ O-Ph |
| 1275 | H | H | Me | H | Ph | 3-Cl-4-EtNHCOCH ₂ O-Ph |
| 1276 | H | H | Me | H | Ph | 3-Cl-4-EtCH(Me)NHCOCH ₂ O-Ph |
| 1277 | H | H | Me | H | Ph | 3-Cl-4-cycloPrNHCOCH ₂ O-Ph |
| 1278 | H | H | Me | H | Ph | 3-Cl-4-cycloPentyNHCOCH ₂ O-Ph |
| 1279 | H | H | Et | H | Ph | 3-Me-4-n-PrNHCOCH ₂ O-Ph |
| 1280 | H | H | Et | H | Ph | 4-i-PrNHCOCH ₂ O-3-Me-Ph |
| 1281 | H | H | Et | H | Ph | 4-EtNHCOCH ₂ O-3-Me-Ph |
| 1282 | H | H | Et | H | Ph | 3-Me-4-MeNHCOCH ₂ O-Ph |
| 1283 | H | H | Et | H | Ph | 3-Me-4-n-BuNHCOCH ₂ O-Ph |
| 1284 | H | H | Et | H | Ph | 4-EtCH(Me)NHCOCH ₂ O-3-Me-Ph |
| 1285 | H | H | Et | H | Ph | 4-EtCOCH ₂ O-3-Me-Ph |
| 1286 | H | H | Et | H | Ph | 4-i-BuNHCOCH ₂ O-3-Me-Ph |
| 1287 | H | H | Pr | H | Ph | 3-Cl-4-n-PrNHCOCH ₂ O-Ph |
| 1288 | H | H | Pr | H | Ph | 3-Cl-4-i-PrNHCOCH ₂ O-Ph |
| 1289 | H | H | Pr | H | Ph | 3-Cl-4-EtNHCOCH ₂ O-Ph |
| 1290 | H | H | Pr | H | Ph | 3-Cl-4-EtCH(Me)NHCOCH ₂ O-Ph |
| 1291 | H | H | Pr | H | Ph | 3-Cl-4-cycloPrNHCOCH ₂ O-Ph |
| 1292 | H | H | Pr | H | Ph | 3-Cl-4-cycloPentyNHCOCH ₂ O-Ph |
| 1293 | H | H | Bu | H | Ph | 3-Me-4-n-PrNHCOCH ₂ O-Ph |
| 1294 | H | H | Bu | H | Ph | 4-i-PrNHCOCH ₂ O-3-Me-Ph |
| 1295 | H | H | Bu | H | Ph | 4-EtNHCOCH ₂ O-3-Me-Ph |

| | | | | | | |
|------|---|---|-------------------|----|----|--|
| 1296 | H | H | Bu | H | Ph | 3-Me-4-MeNHCOCH ₂ O-Ph |
| 1297 | H | H | Bu | H | Ph | 3-Me-4-n-BuNHCOCH ₂ O-Ph |
| 1298 | H | H | Bu | H | Ph | 4-EtCH(Me)NHCOCH ₂ O-3-Me-Ph |
| 1299 | H | H | Bu | H | Ph | 4-EtCOCH ₂ O-3-Me-Ph |
| 1300 | H | H | Bu | H | Ph | 4-i-BuNHCOCH ₂ O-3-Me-Ph |
| 1301 | H | H | i-Bu | H | Ph | 3-Cl-4-n-PrNHCOCH ₂ O-Ph |
| 1302 | H | H | i-Bu | H | Ph | 3-Cl-4-i-PrNHCOCH ₂ O-Ph |
| 1303 | H | H | i-Bu | H | Ph | 3-Cl-4-EtNHCOCH ₂ O-Ph |
| 1304 | H | H | i-Bu | H | Ph | 3-Cl-4-EtCH(Me)NHCOCH ₂ O-Ph |
| 1305 | H | H | i-Bu | H | Ph | 3-Cl-4-cycloPrNHCOCH ₂ O-Ph |
| 1306 | H | H | i-Bu | H | Ph | 3-Cl-4-cycloPentylNHCOCH ₂ O-Ph |
| 1307 | H | H | t-Bu | H | Ph | 3-Me-4-n-PrNHCOCH ₂ O-Ph |
| 1308 | H | H | t-Bu | H | Ph | 4-i-PrNHCOCH ₂ O-3-Me-Ph |
| 1309 | H | H | t-Bu | H | Ph | 4-EtNHCOCH ₂ O-3-Me-Ph |
| 1310 | H | H | t-Bu | H | Ph | 3-Me-4-MeNHCOCH ₂ O-Ph |
| 1311 | H | H | PhCH ₂ | H | Ph | 3-Me-4-n-BuNHCOCH ₂ O-Ph |
| 1312 | H | H | PhCH ₂ | H | Ph | 4-EtCH(Me)NHCOCH ₂ O-3-Me-Ph |
| 1313 | H | H | PhCH ₂ | H | Ph | 4-EtCOCH ₂ O-3-Me-Ph |
| 1314 | H | H | PhCH ₂ | H | Ph | 4-i-BuNHCOCH ₂ O-3-Me-Ph |
| 1315 | H | H | i-Pr | Me | Ph | 3-Cl-4-n-PrNHCOCH ₂ O-Ph |
| 1316 | H | H | i-Pr | Me | Ph | 3-Cl-4-i-PrNHCOCH ₂ O-Ph |
| 1317 | H | H | i-Pr | Me | Ph | 3-Cl-4-EtNHCOCH ₂ O-Ph |
| 1318 | H | H | i-Pr | Me | Ph | 3-Cl-4-EtCH(Me)NHCOCH ₂ O-Ph |

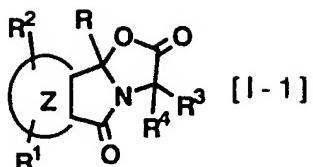
(表8)



| 化合物例 | R ¹ | R ² | R ³ | R ⁴ | Z | R |
|------|----------------|----------------|----------------|----------------|-------------|---|
| 1319 | H | H | i-Pr | Me | Ph | 3-Cl-4-cycloPrNHCOCH ₂ O-Ph |
| 1320 | H | H | i-Pr | Me | Ph | 3-Cl-4-cycloPentyNHCOCH ₂ O-Ph |
| 1321 | H | H | i-Pr | H | 2,3-Pyridyl | 3-Me-4-n-PrNHCOCH ₂ O-Ph |
| 1322 | H | H | i-Pr | H | 2,3-Pyridyl | 4-i-PrNHCOCH ₂ O-3-Me-Ph |
| 1323 | H | H | i-Pr | H | 2,3-Pyridyl | 4-EtNHCOCH ₂ O-3-Me-Ph |
| 1324 | H | H | i-Pr | H | 2,3-Pyridyl | 3-Me-4-MeNHCOCH ₂ O-Ph |
| 1325 | H | H | i-Pr | H | 2,3-Pyridyl | 3-Me-4-n-BuNHCOCH ₂ O-Ph |
| 1326 | H | H | i-Pr | H | 2,3-Pyridyl | 4-EtCH(Me)NHCOCH ₂ O-3-Me-Ph |
| 1327 | H | H | i-Pr | H | 2,3-Pyridyl | 4-EtCOCH ₂ O-3-Me-Ph |
| 1328 | H | H | i-Pr | H | 2,3-Pyridyl | 4-i-BuNHCOCH ₂ O-3-Me-Ph |
| 1329 | H | H | i-Pr | H | 2,3-Pyridyl | 3-Cl-4-n-PrNHCOCH ₂ O-Ph |
| 1330 | H | H | i-Pr | H | 3,4-Pyridyl | 3-Cl-4-i-PrNHCOCH ₂ O-Ph |
| 1331 | H | H | i-Pr | H | 3,4-Pyridyl | 3-Cl-4-EtNHCOCH ₂ O-Ph |
| 1332 | H | H | i-Pr | H | 3,4-Pyridyl | 3-Cl-4-EtCH(Me)NHCOCH ₂ O-Ph |
| 1333 | H | H | i-Pr | H | 3,4-Pyridyl | 3-Cl-4-cycloPrNHCOCH ₂ O-Ph |
| 1334 | H | H | i-Pr | H | 3,4-Pyridyl | 3-Cl-4-cycloPentyNHCOCH ₂ O-Ph |
| 1335 | H | H | i-Pr | H | Ph | 4-F-5-n-PrNHCOCH ₂ O-(2-pyridyl) |
| 1336 | H | H | i-Pr | H | Ph | 4-F-5-i-PrNHCOCH ₂ O-(2-pyridyl) |
| 1337 | H | H | i-Pr | H | Ph | 4-EtNHCOCH ₂ O-3-F-(2-pyridyl) |
| 1338 | H | H | i-Pr | H | Ph | 4-EtCH(Me)NHCOCH ₂ O-3-F-(2-pyridyl) |
| 1339 | H | H | i-Pr | H | Ph | 4-EtCOCH ₂ O-3-F-(2-pyridyl) |
| 1340 | H | H | i-Pr | H | Ph | 3-F-4-i-BuNHCOCH ₂ O-(2-pyridyl) |

| | | | | | | |
|------|---|---|------|---|----|---|
| 1341 | H | H | i-Pr | H | Ph | 4-cycloPrNHCOCH ₂ O-3-F-(2-pyridyl) |
| 1342 | H | H | i-Pr | H | Ph | 5-I-6-n-PrNHCOCH ₂ O-(3-pyridyl) |
| 1343 | H | H | i-Pr | H | Ph | 5-I-6-i-PrNHCOCH ₂ O-(3-pyridyl) |
| 1344 | H | H | i-Pr | H | Ph | 6-EtNHCOCH ₂ O-5-I-(3-pyridyl) |
| 1345 | H | H | i-Pr | H | Ph | 6-EtCH(Me)NHCOCH ₂ O-5-I-(3-pyridyl) |
| 1346 | H | H | i-Pr | H | Ph | 6-EtCOCH ₂ O-5-I-(3-pyridyl) |
| 1347 | H | H | i-Pr | H | Ph | 6-cycloPrNHCOCH ₂ O-5-I-(3-pyridyl) |
| 1348 | H | H | i-Pr | H | Ph | 3-NO ₂ -4-n-PrNHCOCH ₂ O-Ph |
| 1349 | H | H | i-Pr | H | Ph | 3-NO ₂ -4-i-PrNHCOCH ₂ O-Ph |
| 1350 | H | H | i-Pr | H | Ph | 4-EtNHCOCH ₂ O-3-NO ₂ -Ph |
| 1351 | H | H | i-Pr | H | Ph | 4-EtCH(Me)NHCOCH ₂ O-3-NO ₂ -Ph |
| 1352 | H | H | i-Pr | H | Ph | 4-EtCOCH ₂ O-3-NO ₂ -Ph |
| 1353 | H | H | i-Pr | H | Ph | 4-i-BuNHCOCH ₂ O-3-NO ₂ -Ph |
| 1354 | H | H | i-Pr | H | Ph | 4-cycloPrNHCOCH ₂ O-3-NO ₂ -Ph |
| 1355 | H | H | i-Pr | H | Ph | 3-MeO-4-n-PrNHCOCH ₂ O-Ph |
| 1356 | H | H | i-Pr | H | Ph | 3-MeO-4-i-PrNHCOCH ₂ O-Ph |
| 1357 | H | H | i-Pr | H | Ph | 4-EtNHCOCH ₂ O-3-MeO-Ph |
| 1358 | H | H | i-Pr | H | Ph | 4-EtCH(Me)NHCOCH ₂ O-3-MeO-Ph |
| 1359 | H | H | i-Pr | H | Ph | 4-EtCOCH ₂ O-3-MeO-Ph |
| 1360 | H | H | i-Pr | H | Ph | 3-MeO-4-i-BuNHCOCH ₂ O-Ph |
| 1361 | H | H | i-Pr | H | Ph | 4-cycloPrNHCOCH ₂ O-3-MeO-Ph |
| 1362 | H | H | i-Pr | H | Ph | 3-HO-4-n-PrNHCOCH ₂ O-Ph |
| 1363 | H | H | i-Pr | H | Ph | 3-HO-4-i-PrNHCOCH ₂ O-Ph |

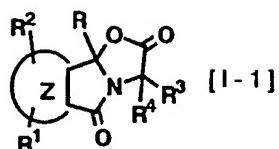
(表9)



| 化合物例 | R ¹ | R ² | R ³ | R ⁴ | Z | R |
|------|----------------|----------------|----------------|----------------|----|---|
| 1364 | H | H | i-Pr | H | Ph | 4-EtNHCOCH ₂ O-3-HO-Ph |
| 1365 | H | H | i-Pr | H | Ph | 4-EtCH(Me)NHCOCH ₂ O-3-HO-Ph |
| 1366 | H | H | i-Pr | H | Ph | 4-EtCOCH ₂ O-3-HO-Ph |
| 1367 | H | H | i-Pr | H | Ph | 3-HO-4-i-BuNHCOCH ₂ O-Ph |
| 1368 | H | H | i-Pr | H | Ph | 4-cycloPrNHCOCH ₂ O-3-HO-Ph |
| 1369 | H | H | i-Pr | H | Ph | 3-H ₂ NCH ₂ CH ₂ NHCOCH ₂ O-Ph |
| 1370 | H | H | i-Pr | H | Ph | 2-H ₂ NCH ₂ CH ₂ NHCOCH ₂ O-Ph |
| 1371 | H | H | i-Pr | H | Ph | 4-MeNHCH ₂ CH ₂ NHCOCH ₂ O-Ph |
| 1372 | H | H | i-Pr | H | Ph | 3-MeNHCH ₂ CH ₂ NHCOCH ₂ O-Ph |
| 1373 | H | H | i-Pr | H | Ph | 2-MeNHCH ₂ CH ₂ NHCOCH ₂ O-Ph |
| 1374 | H | H | i-Pr | H | Ph | 4-Me ₂ NCH ₂ CH ₂ NHCOCH ₂ O-Ph |
| 1375 | H | H | i-Pr | H | Ph | 3-Me ₂ NCH ₂ CH ₂ NHCOCH ₂ O-Ph |
| 1376 | H | H | i-Pr | H | Ph | 2-Me ₂ NCH ₂ CH ₂ NHCOCH ₂ O-Ph |
| 1377 | H | H | i-Pr | H | Ph | 4-H ₂ NCH ₂ CH ₂ NHCOCH ₂ O-3-Cl-Ph |
| 1378 | H | H | i-Pr | H | Ph | 3-H ₂ NCH ₂ CH ₂ NHCOCH ₂ O-4-Cl-Ph |
| 1379 | H | H | i-Pr | H | Ph | 2-H ₂ NCH ₂ CH ₂ NHCOCH ₂ O-4-Cl-Ph |
| 1380 | H | H | i-Pr | H | Ph | 4-MeNHCH ₂ CH ₂ NHCOCH ₂ O-3-Me-Ph |
| 1381 | H | H | i-Pr | H | Ph | 3-MeNHCH ₂ CH ₂ NHCOCH ₂ O-4-Me-Ph |
| 1382 | H | H | i-Pr | H | Ph | 2-MeNHCH ₂ CH ₂ NHCOCH ₂ O-4-MePh |
| 1383 | H | H | i-Pr | H | Ph | 4-Me ₂ NCH ₂ CH ₂ NHCOCH ₂ O-3-F-Ph |
| 1384 | H | H | i-Pr | H | Ph | 3-Me ₂ NCH ₂ CH ₂ NHCOCH ₂ O-4-F-Ph |
| 1385 | H | H | i-Pr | H | Ph | 2-Me ₂ NCH ₂ CH ₂ NHCOCH ₂ O-4-F-Ph |
| 1386 | H | H | i-Pr | H | Ph | 4-H ₂ NCOCH ₂ -3-I-Ph |

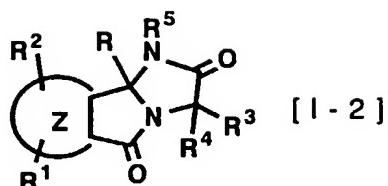
| | | | | | | |
|------|---|---|------|---|----|--|
| 1387 | H | H | i-Pr | H | Ph | 3-I-4-MeNHCOCH ₂ -Ph |
| 1388 | H | H | i-Pr | H | Ph | 4-EtNHCOCH ₂ -3-I-Ph |
| 1389 | H | H | i-Pr | H | Ph | 3-I-4-nPrNHCOCH ₂ -Ph |
| 1390 | H | H | i-Pr | H | Ph | 3-I-4-iPrNHCOCH ₂ -Ph |
| 1391 | H | H | i-Pr | H | Ph | 4-nBuNHCOCH ₂ -3-I-Ph |
| 1392 | H | H | i-Pr | H | Ph | 4-tBuNHCOCH ₂ -3-I-Ph |
| 1393 | H | H | i-Pr | H | Ph | 4-iBuNHCOCH ₂ -Ph |
| 1394 | H | H | i-Pr | H | Ph | 4-tBuO ₂ CCH ₂ -3-I-Ph |
| 1395 | H | H | i-Pr | H | Ph | 3-I-4-PhCH ₂ NHCOCH ₂ -Ph |
| 1396 | H | H | i-Pr | H | Ph | 3-I-4-(2-tetrahydrofuryl)CH ₂ NHCOCH ₂ - |
| 1397 | H | H | i-Pr | H | Ph | 4-cycloPrNHCOCH ₂ -3-I-Ph |
| 1398 | H | H | i-Pr | H | Ph | 4-cycloPentylNHCOCH ₂ -3-I-Ph |
| 1399 | H | H | i-Pr | H | Ph | 4-cycloHexylNHCOCH ₂ -3-I-Ph |
| 1400 | H | H | i-Pr | H | Ph | 4-cycloPrNHCOCH ₂ -3-F-Ph |
| 1401 | H | H | i-Pr | H | Ph | 3-Cl-4-i-PrNHCOCH ₂ CH ₂ -Ph |
| 1402 | H | H | i-Pr | H | Ph | 3-Cl-4-EtNHCOCH ₂ CH ₂ -Ph |
| 1403 | H | H | i-Pr | H | Ph | 3-Cl-4-EtCH(Me)NHCOCH ₂ CH ₂ -Ph |
| 1404 | H | H | i-Pr | H | Ph | 4-i-PrNHCO-3-Me-Ph |
| 1405 | H | H | i-Pr | H | Ph | 4-EtNHCO-3-Me-Ph |
| 1406 | H | H | i-Pr | H | Ph | 4-EtCH(Me)NHCO-3-Me-Ph |
| 1407 | H | H | i-Pr | H | Ph | 3-Cl-4-i-PrNHCH ₂ CH ₂ O-Ph |
| 1408 | H | H | i-Pr | H | Ph | 3-Cl-4-EtNHCH ₂ CH ₂ O-Ph |
| 1409 | H | H | i-Pr | H | Ph | 3-Cl-4-EtCH(Me)NHCH ₂ CH ₂ O-Ph |

(表10)



| 化合物例 | R ¹ | R ² | R ³ | R ⁴ | Z | R |
|------|----------------|----------------|---|----------------|---------------|--|
| 1410 | H | H | i-Pr | H | 2,3-anthryl | 4-nBuNHCOCH ₂ O-Ph |
| 1411 | H | H | i-Pr | H | 2,3-indenyl | 4-nPrNHCOCH ₂ O-Ph |
| 1412 | H | H | i-Pr | H | 2,3-naphthyl | 4-nPrNHCOCH ₂ O-Ph |
| 1413 | H | H | i-Pr | H | 2,3-pyrazinyl | 4-nPrNHCOCH ₂ O-Ph |
| 1414 | H | H | i-Pr | H | Ph | 3-PhO-4-nPrNHCOCH ₂ O-Ph |
| 1415 | H | H | i-Pr | H | Ph | 3-PhCH ₂ O-4-MeO ₂ CNH ₂ CH ₂ NHCOCH ₂ O-Ph |
| 1416 | H | H | i-Pr | H | Ph | 3-Ph ₂ N-4-nPrNHCOCH ₂ O-Ph |
| 1417 | H | H | i-Pr | H | Ph | 3-PhCH ₂ CH ₂ N-4-nPrNHCOCH ₂ O-Ph |
| 1418 | H | H | i-Pr | H | Ph | 3-PhCH ₂ CH ₂ N-4-nPrNHCOCH ₂ O-Ph |
| 1419 | H | H | i-Pr | H | Ph | 3-PhSO ₃ -4-nPrNHCOCH ₂ O-Ph |
| 1420 | H | H | i-Pr | H | Ph | 3-Me-4-nPrNHCOCH ₂ S-Ph |
| 1421 | H | H | i-Pr | H | Ph | 3-PhNSO ₂ -4-nPrNHCOCH ₂ O-Ph |
| 1422 | H | H | i-Pr | H | Ph | 3-PhCH ₂ CO-4-nPrNHCOCH ₂ O-Ph |
| 1423 | H | H | H ₂ NCO-PhCH ₂ | H | Ph | 4-nPrNHCOCH ₂ O-Ph |
| 1424 | H | H | MeCO-PhCH ₂ | H | Ph | 4-nPrNHCOCH ₂ O-Ph |
| 1425 | H | H | H ₂ NCH ₂ CH ₂ | H | Ph | 4-nPrNHCOCH ₂ O-Ph |
| 1426 | H | H | MeO ₂ C-PhCH ₂ | H | Ph | 4-nPrNHCOCH ₂ O-Ph |
| 1427 | H | H | D-Glutamic Acid | H | Ph | 3-Me-4-nPrNHCOCH ₂ O-Ph |
| 1428 | H | H | L-Glutamic Acid | H | Ph | 3-Me-4-nPrNHCOCH ₂ O-Ph |
| 1429 | H | H | (3-Pyridyl)CH ₂ | H | Ph | 3-Me-4-nPrNHCOCH ₂ O-Ph |
| 1430 | H | H | i-Pr | H | Ph | 4-n-PrNHCOCH ₂ O-3-CH ₂ =CH-Ph |
| 1431 | H | H | i-Pr | H | Ph | 4-n-PrNHCOCH ₂ O-3-(2-Pyridyl)-Ph |
| 1432 | H | H | i-Pr | H | Ph | 4-n-PrNHCOCH ₂ O-3-(3-Pyridyl)-Ph |
| 1433 | H | H | i-Pr | H | Ph | 4-n-PrNHCOCH ₂ O-3-(4-Pyridyl)-Ph |
| 1434 | H | H | i-Pr | H | Ph | 3-Ph-4-n-PrNHCOCH ₂ O-Ph |
| 1435 | H | H | i-Pr | H | Ph | 3-Et-4-n-PrNHCOCH ₂ O-Ph |
| 1436 | H | H | i-Pr | H | Ph | 3-n-Bu-4-n-PrNHCOCH ₂ O-Ph |
| 1437 | H | H | i-Pr | H | Ph | 3-MeO-6-Me-Ph |
| 1438 | H | H | i-Pr | H | Ph | 3-HO-6-Me-Ph |
| 1439 | H | H | i-Pr | H | Ph | 6-Me-3-n-PrNHCOCH ₂ O-Ph |

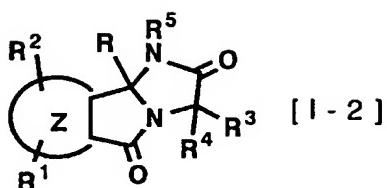
(表11)



| 化合物例 | R ¹ | R ² | R ³ | R ⁴ | R ⁵ | Z | R |
|------|----------------|----------------|----------------|----------------|----------------|----|---|
| 2001 | H | H | i-Pr | H | H | Ph | 2-MeO-Ph |
| 2002 | H | H | i-Pr | H | H | Ph | Ph |
| 2003 | H | H | i-Pr | H | H | Ph | 2-NH ₂ -Ph |
| 2004 | H | H | i-Pr | H | H | Ph | 4-F-Ph |
| 2005 | H | H | i-Pr | H | H | Ph | 4-Et ₂ N-Ph |
| 2006 | H | H | i-Pr | H | H | Ph | 4-Cl-Ph |
| 2007 | H | H | i-Pr | H | H | Ph | 4-HO-Ph |
| 2008 | H | H | i-Pr | H | H | Ph | 3-MeO-Ph |
| 2009 | H | H | i-Pr | H | H | Ph | 3-HO-Ph |
| 2010 | H | H | i-Pr | H | H | Ph | 3-NH ₂ -Ph |
| 2011 | H | H | i-Pr | H | H | Ph | 4-MeO-Ph |
| 2012 | H | H | i-Pr | H | H | Ph | 4-Me-Ph |
| 2013 | H | H | i-Pr | H | H | Ph | 3-Me-Ph |
| 2014 | H | H | i-Pr | H | H | Ph | 4-tBuO ₂ CCH ₂ O-Ph |
| 2015 | H | H | i-Pr | H | H | Ph | 4-HO ₂ CCH ₂ O-Ph |
| 2016 | H | H | i-Pr | H | H | Ph | 4-tBuO ₂ C(CH ₂) ₅ O-Ph |
| 2017 | H | H | i-Pr | H | H | Ph | 4-HO ₂ C(CH ₂) ₅ O-Ph |
| 2018 | H | H | i-Pr | H | H | Ph | 4-HO(CH ₂) ₃ O-Ph |
| 2019 | H | H | i-Pr | H | H | Ph | 4-HO(CH ₂) ₂ O-Ph |
| 2020 | H | H | i-Pr | H | H | Ph | 4-HOC(Me) ₂ (CH ₂) ₂ O-Ph |
| 2021 | H | H | i-Pr | H | H | Ph | 4-PhCH ₂ O-Ph |
| 2022 | H | H | i-Pr | H | H | Ph | 4-MeNHCOCH ₂ O-Ph |
| 2023 | H | H | i-Pr | H | H | Ph | 4-EtNHCOCH ₂ O-Ph |

| | | | | | | | |
|------|---|---|------|---|---|----|---|
| 2024 | H | H | i-Pr | H | H | Ph | 4-nPrNHCOCH ₂ O-Ph |
| 2025 | H | H | i-Pr | H | H | Ph | 4-nBuNHCOCH ₂ O-Ph |
| 2026 | H | H | i-Pr | H | H | Ph | 4-CH ₂ =CHCH ₂ NHCOCH ₂ O-Ph |
| 2027 | H | H | i-Pr | H | H | Ph | 4-Me(CH ₂) ₉ NHCOCH ₂ O-Ph |
| 2028 | H | H | i-Pr | H | H | Ph | 4-N ₃ (CH ₂) ₃ O-Ph |
| 2029 | H | H | i-Pr | H | H | Ph | 4-tBuO ₂ CCH(Me)O-Ph |
| 2030 | H | H | i-Pr | H | H | Ph | 4-nPrNHCOCH(Me)O-Ph |
| 2031 | H | H | i-Pr | H | H | Ph | 4-F ₃ CSO ₃ -Ph |
| 2032 | H | H | i-Pr | H | H | Ph | 4-tBuO ₂ CCH=CHPh |
| 2033 | H | H | i-Pr | H | H | Ph | 4-nPrNHCOCH=CH-Ph |
| 2034 | H | H | i-Pr | H | H | Ph | 4-nPrCH(Me)NHCOCH ₂ O-Ph |
| 2035 | H | H | i-Pr | H | H | Ph | 4-EtCH(Me)NHCOCH ₂ O-Ph |
| 2036 | H | H | i-Pr | H | H | Ph | 4-MeOCH ₂ O-Ph |
| 2037 | H | H | i-Pr | H | H | Ph | 4-EtCOCH ₂ O-Ph |
| 2038 | H | H | i-Pr | H | H | Ph | 3-tBuO ₂ CCH ₂ O-Ph |
| 2039 | H | H | i-Pr | H | H | Ph | 3-HO ₂ CCH ₂ O-Ph |
| 2040 | H | H | i-Pr | H | H | Ph | 3-nPrNHCOCH ₂ O-Ph |
| 2041 | H | H | i-Pr | H | H | Ph | 4-H ₂ NC(Me) ₂ CH ₂ O ₂ CCH ₂ O-Ph |
| 2042 | H | H | i-Pr | H | H | Ph | 4-morpholinoCOCH ₂ O-Ph |
| 2043 | H | H | i-Pr | H | H | Ph | 4-(4-Cl-Ph)-COCH ₂ O-Ph |
| 2044 | H | H | i-Pr | H | H | Ph | 4-PhCOCH ₂ O-Ph |
| 2045 | H | H | i-Pr | H | H | Ph | 4-(4-pyridyl)-CH ₂ NHCOCH ₂ O-Ph |
| 2046 | H | H | i-Pr | H | H | Ph | 4-H ₂ NCH ₂ CH ₂ NHCOCH ₂ O-Ph |
| 2047 | H | H | i-Pr | H | H | Ph | 4-Cl-3-NO ₂ -Ph |

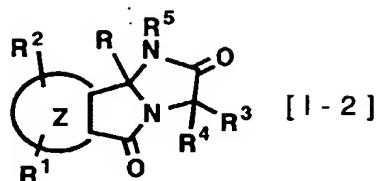
(表12)



| 化合物例 | R ¹ | R ² | R ³ | R ⁴ | R ⁵ | Z | R |
|------|----------------|----------------|----------------|----------------|----------------|----|---|
| 2048 | H | H | i-Pr | H | H | Ph | 4-Cl-3-F-Ph |
| 2049 | H | H | i-Pr | H | H | Ph | 4-Cl-3-Me-Ph |
| 2050 | H | H | i-Pr | H | H | Ph | 3-NH ₂ -4-Cl-Ph |
| 2051 | H | H | i-Pr | H | H | Ph | 3-Cl-4-MeO-Ph |
| 2052 | H | H | i-Pr | H | H | Ph | 3-Cl-4-Me-Ph |
| 2053 | H | H | i-Pr | H | H | Ph | 4-Br-3-Cl-Ph |
| 2054 | H | H | i-Pr | H | H | Ph | 4-Br-2-Cl-Ph |
| 2055 | H | H | i-Pr | H | H | Ph | 4-F-3-Me-Ph |
| 2056 | H | H | i-Pr | H | H | Ph | 3-F-4-Me-Ph |
| 2057 | H | H | i-Pr | H | H | Ph | 3-Br-4-HO-Ph |
| 2058 | H | H | i-Pr | H | H | Ph | 3-Br-4-MeO-Ph |
| 2059 | H | H | i-Pr | H | H | Ph | 3-Br-4-F-Ph |
| 2060 | H | H | i-Pr | H | H | Ph | 3-F-4-PhPh |
| 2061 | H | H | i-Pr | H | H | Ph | 4-HO-3-I-Ph |
| 2062 | H | H | i-Pr | H | H | Ph | 5-HO-2-I-Ph |
| 2063 | H | H | i-Pr | H | H | Ph | 3-I-4-MeO-Ph |
| 2064 | H | H | i-Pr | H | H | Ph | 2-I-5-MeO-Ph |
| 2065 | H | H | i-Pr | H | H | Ph | 4-MeO-3-Me-Ph |
| 2066 | H | H | i-Pr | H | H | Ph | 4-HO(CH ₂) ₃ O-3-I-Ph |
| 2067 | H | H | i-Pr | H | H | Ph | 4-HO(CH ₂) ₂ O-3-I-Ph |
| 2068 | H | H | i-Pr | H | H | Ph | 4-HOC(Me) ₂ (CH ₂) ₂ O-3-I-Ph |
| 2069 | H | H | i-Pr | H | H | Ph | 4-tBuO ₂ C(CH ₂) ₄ O-3-I-Ph |
| 2070 | H | H | i-Pr | H | H | Ph | 3-I-4-PhCH ₂ O-Ph |

| | | | | | | | |
|------|---|---|------|---|---|----|---|
| 2071 | H | H | i-Pr | H | H | Ph | 4-H ₂ NCOCH ₂ O-3-I-Ph |
| 2072 | H | H | i-Pr | H | H | Ph | 3-I-4-MeNHCOCH ₂ O-Ph |
| 2073 | H | H | i-Pr | H | H | Ph | 4-EtNHCOCH ₂ O-3-I-Ph |
| 2074 | H | H | i-Pr | H | H | Ph | 3-I-4-nPrNHCOCH ₂ O-Ph |
| 2075 | H | H | i-Pr | H | H | Ph | 3-I-4-iPrNHCOCH ₂ O-Ph |
| 2076 | H | H | i-Pr | H | H | Ph | 4-nBuNHCOCH ₂ O-3-I-Ph |
| 2077 | H | H | i-Pr | H | H | Ph | 4-tBuNHCOCH ₂ O-3-I-Ph |
| 2078 | H | H | i-Pr | H | H | Ph | 4-iBuNHCOCH ₂ O-Ph |
| 2079 | H | H | i-Pr | H | H | Ph | 4-tBuO ₂ CCH ₂ O-3-I-Ph |
| 2080 | H | H | i-Pr | H | H | Ph | 3-I-4-PhCH ₂ NHCOCH ₂ O-Ph |
| 2081 | H | H | i-Pr | H | H | Ph | 3-I-4-(2-tetrahydrofuryl)CH ₂ NHCOCH ₂ O-Ph |
| 2082 | H | H | i-Pr | H | H | Ph | 4-cycloPrNHCOCH ₂ O-3-I-Ph |
| 2083 | H | H | i-Pr | H | H | Ph | 4-cycloPentyNHCOCH ₂ O-3-I-Ph |
| 2084 | H | H | i-Pr | H | H | Ph | 4-cycloHexyNHCOCH ₂ O-3-I-Ph |
| 2085 | H | H | i-Pr | H | H | Ph | 4-cycloPrNHCOCH ₂ O-3-F-Ph |
| 2086 | H | H | i-Pr | H | H | Ph | 4-Me(CH ₂) ₉ NHCOCH ₂ O-3-I-Ph |
| 2087 | H | H | i-Pr | H | H | Ph | 4-HO ₂ CCH ₂ O-3-I-Ph |
| 2088 | H | H | i-Pr | H | H | Ph | 4-N ₃ (CH ₂) ₃ O-3-I-Ph |
| 2089 | H | H | i-Pr | H | H | Ph | 3-I-4-nPrNHCO(CH ₂) ₄ O-Ph |
| 2090 | H | H | i-Pr | H | H | Ph | 4-Et ₂ NCOCH ₂ O-3-I-Ph |
| 2091 | H | H | i-Pr | H | H | Ph | 3-I-4-nPrN(Me)COCH ₂ O-Ph |
| 2092 | H | H | i-Pr | H | H | Ph | 3-Cl-4-nPrNHCOCH ₂ O-Ph |
| 2093 | H | H | i-Pr | H | H | Ph | 3-Br-4-nPrNHCOCH ₂ O-Ph |
| 2094 | H | H | i-Pr | H | H | Ph | 3-F-4-nPrNHCOCH ₂ O-Ph |

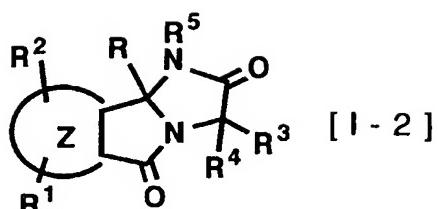
(表13)



| 化合物例 | R ¹ | R ² | R ³ | R ⁴ | R ⁵ | Z | R |
|------|----------------|----------------|----------------|----------------|----------------|----|--|
| 2095 | H | H | i-Pr | H | H | Ph | 3-Me-4-nPrNHCOCH ₂ O-Ph |
| 2096 | H | H | i-Pr | H | H | Ph | 4-EtNHCOCH ₂ O-3-F-Ph |
| 2097 | H | H | i-Pr | H | H | Ph | 3-I-4-iPrNHCO(Me) ₂ CH ₂ O-Ph |
| 2098 | H | H | i-Pr | H | H | Ph | 3-Br-4-CH ₂ =CHCH ₂ NHCOCH ₂ O-Ph |
| 2099 | H | H | i-Pr | H | H | Ph | 4-iBuNHCOCH ₂ O-3-F-Ph |
| 2100 | H | H | i-Pr | H | H | Ph | 3-tBuO ₂ CCH=CH-4-nPrNHCOCH ₂ O-Ph |
| 2101 | H | H | i-Pr | H | H | Ph | 3-HO ₂ CCH=CH-4-nPrNHCOCH ₂ O-Ph |
| 2102 | H | H | i-Pr | H | H | Ph | 3-I-4-MeOCH ₂ CH ₂ NHCOCH ₂ O-Ph |
| 2103 | H | H | i-Pr | H | H | Ph | 3-F-4-HO-Ph |
| 2104 | H | H | i-Pr | H | H | Ph | 3-F-4-MeO-Ph |
| 2105 | H | H | i-Pr | H | H | Ph | 3,4-methylenedioxyPh |
| 2106 | H | H | i-Pr | H | H | Ph | 3,4-ethylenedioxyPh |
| 2107 | H | H | i-Pr | H | H | Ph | 3,4-Cl ₂ -Ph |
| 2108 | H | H | i-Pr | H | H | Ph | 3,4-Me ₂ -Ph |
| 2109 | H | H | i-Pr | H | H | Ph | 3,4-F ₂ -Ph |
| 2110 | H | H | i-Pr | H | H | Ph | 3,4-(MeO) ₂ -Ph |
| 2111 | H | H | i-Pr | H | H | Ph | 3,5-(MeO) ₂ -Ph |
| 2112 | H | H | i-Pr | H | H | Ph | 3,5-Me ₂ -Ph |
| 2113 | H | H | i-Pr | H | H | Ph | 3,5-I ₂ -4-HO-Ph |
| 2114 | H | H | i-Pr | H | H | Ph | 2,4-I ₂ -5-HO-Ph |
| 2115 | H | H | i-Pr | H | H | Ph | 3,5-I ₂ -4-MeO-Ph |
| 2116 | H | H | i-Pr | H | H | Ph | 2,4-I ₂ -5-MeO-Ph |
| 2117 | H | H | i-Pr | H | H | Ph | 2,4,6-Me ₃ -Ph |
| 2118 | H | H | i-Pr | H | H | Ph | 4-HO(CH ₂) ₃ O-3,5-I ₂ Ph |

| | | | | | | | |
|------|---------------------|---|------|---|---|----|---|
| 2119 | H | H | i-Pr | H | H | Ph | 3,5-I ₂ -4-nPrNHCOCH ₂ O-Ph |
| 2120 | H | H | i-Pr | H | H | Ph | 2-thienyl |
| 2121 | H | H | i-Pr | H | H | Ph | 2-furyl |
| 2122 | H | H | i-Pr | H | H | Ph | 3-pyridyl |
| 2123 | H | H | i-Pr | H | H | Ph | 2-naphthyl |
| 2124 | H | H | i-Pr | H | H | Ph | 5-F-1-naphthyl |
| 2125 | H | H | i-Pr | H | H | Ph | dibenzothiophene-2-yl |
| 2126 | 6-F | H | i-Pr | H | H | Ph | Ph |
| 2127 | 7-F | H | i-Pr | H | H | Ph | Ph |
| 2128 | 8-F | H | i-Pr | H | H | Ph | Ph |
| 2129 | 9-F | H | i-Pr | H | H | Ph | Ph |
| 2130 | 6-MeO | H | i-Pr | H | H | Ph | Ph |
| 2131 | 9-MeO | H | i-Pr | H | H | Ph | Ph |
| 2132 | 6-OH | H | i-Pr | H | H | Ph | Ph |
| 2133 | 9-OH | H | i-Pr | H | H | Ph | Ph |
| 2134 | 7-NO ₂ | H | i-Pr | H | H | Ph | Ph |
| 2135 | 8-NO ₂ | H | i-Pr | H | H | Ph | Ph |
| 2136 | 9-NO ₂ | H | i-Pr | H | H | Ph | Ph |
| 2137 | 6-NHPh | H | i-Pr | H | H | Ph | Ph |
| 2138 | 7-Me ₂ N | H | i-Pr | H | H | Ph | Ph |
| 2139 | 7-Me | H | i-Pr | H | H | Ph | Ph |
| 2140 | 8-Me | H | i-Pr | H | H | Ph | Ph |
| 2141 | 7-t-Bu | H | i-Pr | H | H | Ph | Ph |

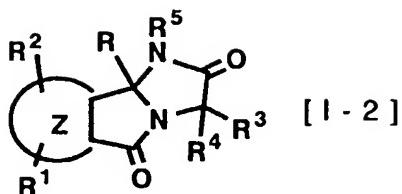
(表14)



| 化合物例 | R ¹ | R ² | R ³ | R ⁴ | R ⁵ | Z | R |
|------|----------------|----------------|----------------|----------------|----------------|--------------|----|
| 2142 | 8-t-Bu | H | i-Pr | H | H | Ph | Ph |
| 2143 | 7-Br | H | i-Pr | H | H | Ph | Ph |
| 2144 | 8-Br | H | i-Pr | H | H | Ph | Ph |
| 2145 | 7-Cl | H | i-Pr | H | H | Ph | Ph |
| 2146 | 8-Cl | H | i-Pr | H | H | Ph | Ph |
| 2147 | 7-Cl | 8-Cl | i-Pr | H | H | Ph | Ph |
| 2148 | 6-Cl | 9-Cl | i-Pr | H | H | Ph | Ph |
| 2149 | 6-OH | 9-I | i-Pr | H | H | Ph | Ph |
| 2150 | H | H | i-Pr | H | H | 1,2-naphthyl | Ph |
| 2151 | H | H | i-Pr | H | H | 2,3-naphthyl | Ph |
| 2152 | H | H | i-Pr | H | H | cyclohexenyl | Ph |
| 2153 | H | H | D-Leucine | H | H | Ph | Ph |
| 2154 | H | H | L-Leucine | H | H | Ph | Ph |
| 2155 | H | H | D-NorLeucine | H | H | Ph | Ph |
| 2156 | H | H | L-NorLeucine | H | H | Ph | Ph |
| 2157 | H | H | D-AlloLeucine | H | H | Ph | Ph |
| 2158 | H | H | L-AlloLeucine | H | H | Ph | Ph |
| 2159 | H | H | D-NorValine | H | H | Ph | Ph |
| 2160 | H | H | L-NorValine | H | H | Ph | Ph |
| 2161 | H | H | D-Alanine | H | H | Ph | Ph |
| 2162 | H | H | L-Alanine | H | H | Ph | Ph |
| 2163 | H | H | D-Arginine | H | H | Ph | Ph |
| 2164 | H | H | L-Arginine | H | H | Ph | Ph |

| | | | | | | | |
|------|---|---|-----------------------|---|---|----|---------|
| 2165 | H | H | D-Asparagine | H | H | Ph | Ph |
| 2166 | H | H | L-Asparagine | H | H | Ph | Ph |
| 2167 | H | H | D-Glutamic Acid | H | H | Ph | Ph |
| 2168 | H | H | L-Glutamic Acid | H | H | Ph | Ph |
| 2169 | H | H | D-Glutamine | H | H | Ph | Ph |
| 2170 | H | H | L-Glutamine | H | H | Ph | Ph |
| 2171 | H | H | D-Histidine | H | H | Ph | Ph |
| 2172 | H | H | L-Histidine | H | H | Ph | Ph |
| 2173 | H | H | D-Methionine | H | H | Ph | Ph |
| 2174 | H | H | L-Methionine | H | H | Ph | Ph |
| 2175 | H | H | D-Tryptophan | H | H | Ph | Ph |
| 2176 | H | H | L-Tryptophan | H | H | Ph | Ph |
| 2177 | H | H | D-Tyrosine | H | H | Ph | Ph |
| 2178 | H | H | L-Tyrosine | H | H | Ph | Ph |
| 2179 | H | H | D- Homo Phenylalanine | H | H | Ph | Ph |
| 2180 | H | H | L- Homo Phenylalanine | H | H | Ph | Ph |
| 2181 | H | H | D-Leucine | H | H | Ph | 4-Cl-Ph |
| 2182 | H | H | L-Leucine | H | H | Ph | 4-Cl-Ph |
| 2183 | H | H | D- NorLeucine | H | H | Ph | 4-Cl-Ph |
| 2184 | H | H | L- NorLeucine | H | H | Ph | 4-Cl-Ph |
| 2185 | H | H | D- AlloLeucine | H | H | Ph | 4-Cl-Ph |
| 2186 | H | H | L- AlloLeucine | H | H | Ph | 4-Cl-Ph |
| 2187 | H | H | D- NorValine | H | H | Ph | 4-Cl-Ph |

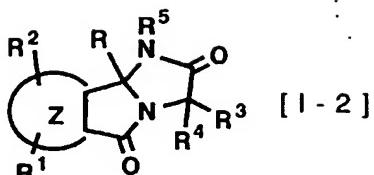
(表15)



| 化合物例 | R ¹ | R ² | R ³ | R ⁴ | R ⁵ | Z | R |
|------|----------------|----------------|---------------------------------------|----------------|----------------|----|---------|
| 2188 | H | H | L-NorValine | H | H | Ph | 4-Cl-Ph |
| 2189 | H | H | D-Alanine | H | H | Ph | 4-Cl-Ph |
| 2190 | H | H | L-Alanine | H | H | Ph | 4-Cl-Ph |
| 2191 | H | H | D-Arginine | H | H | Ph | 4-Cl-Ph |
| 2192 | H | H | L-Arginine | H | H | Ph | 4-Cl-Ph |
| 2193 | H | H | D-Asparagine | H | H | Ph | 4-Cl-Ph |
| 2194 | H | H | L-Asparagine | H | H | Ph | 4-Cl-Ph |
| 2195 | H | H | D-Glutamic Acid | H | H | Ph | 4-Cl-Ph |
| 2196 | H | H | L-Glutamic Acid | H | H | Ph | 4-Cl-Ph |
| 2197 | H | H | D-Glutamine | H | H | Ph | 4-Cl-Ph |
| 2198 | H | H | L-Glutamine | H | H | Ph | 4-Cl-Ph |
| 2199 | H | H | D-Histidine | H | H | Ph | 4-Cl-Ph |
| 2200 | H | H | L-Histidine | H | H | Ph | 4-Cl-Ph |
| 2201 | H | H | D-Methionine | H | H | Ph | 4-Cl-Ph |
| 2202 | H | H | L-Methionine | H | H | Ph | 4-Cl-Ph |
| 2203 | H | H | D-Tryptophan | H | H | Ph | 4-Cl-Ph |
| 2204 | H | H | L-Tryptophan | H | H | Ph | 4-Cl-Ph |
| 2205 | H | H | D-Tyrosine | H | H | Ph | 4-Cl-Ph |
| 2206 | H | H | L-Tyrosine | H | H | Ph | 4-Cl-Ph |
| 2207 | H | H | D-Homo Phenylalanine | H | H | Ph | 4-Cl-Ph |
| 2208 | H | H | L-Homo Phenylalanine | H | H | Ph | 4-Cl-Ph |
| 2209 | H | H | t-Bu | H | H | Ph | Ph |
| 2210 | H | H | (CH ₃) ₂ (OH)C | H | H | Ph | Ph |

| | | | | | | | |
|------|---|---|---|----|---|----|--|
| 2211 | H | H | CH ₃ (MeO)CH | H | H | Ph | Ph |
| 2212 | H | H | 4-HO-Ph | H | H | Ph | Ph |
| 2213 | H | H | 4-HO-3-I-Ph | H | H | Ph | Ph |
| 2214 | H | H | 4-HO-3,5-I ₂ -Ph | H | H | Ph | Ph |
| 2215 | H | H | 4-HO-3-I-PhCH ₂ | H | H | Ph | Ph |
| 2216 | H | H | 4-HO-3,5-I ₂ -PhCH ₂ | H | H | Ph | Ph |
| 2217 | H | H | 1-naphthylmethyl | H | H | Ph | Ph |
| 2218 | H | H | 4-F-PhCH ₂ | H | H | Ph | Ph |
| 2219 | H | H | 1-naphthylmethyl | H | H | Ph | 4-Cl-Ph |
| 2220 | H | H | 4-F-PhCH ₂ | H | H | Ph | 4-Cl-Ph |
| 2221 | H | H | i-Pr | Me | H | Ph | 4-Cl-Ph |
| 2222 | H | H | Me | Me | H | Ph | Ph |
| 2223 | H | H | (R ⁴ と一緒になって)CH ₂ = | - | H | Ph | Ph |
| 2224 | H | H | (R ⁴ と一緒になって)MeCH= | - | H | Ph | Ph |
| 2225 | H | H | (R ⁴ と一緒になって)(CH ₂) ₄ | - | H | Ph | Ph |
| 2226 | H | H | i-Pr | H | H | Ph | 4-n-PrNHCOCH ₂ CH ₂ O-Ph |
| 2227 | H | H | i-Pr | H | H | Ph | 4-i-PrNHCOCH ₂ CH ₂ O-Ph |
| 2228 | H | H | i-Pr | H | H | Ph | 4-EtNHCOCH ₂ CH ₂ O-Ph |
| 2229 | H | H | i-Pr | H | H | Ph | 4-EtCH(Me)NHCOCH ₂ CH ₂ O-Ph |
| 2230 | H | H | i-Pr | H | H | Ph | 3-Cl-4-i-PrNHCOCH ₂ O-Ph |
| 2231 | H | H | i-Pr | H | H | Ph | 3-Cl-4-EtNHCOCH ₂ O-Ph |
| 2232 | H | H | i-Pr | H | H | Ph | 3-Cl-4-EtCH(Me)NHCOCH ₂ O-Ph |
| 2233 | H | H | i-Pr | H | H | Ph | 4-i-PrNHCOCH ₂ O-3-Me-Ph |

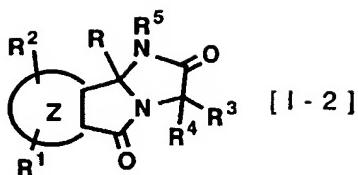
(表16)



| 化合物例 | R ¹ | R ² | R ³ | R ⁴ | R ⁵ | Z | R |
|------|----------------|----------------|----------------|----------------|----------------|----|---|
| 2234 | H | H | i-Pr | H | H | Ph | 4-EtNHCOCH ₂ O-3-Me-Ph |
| 2235 | H | H | i-Pr | H | H | Ph | 4-EtCH(Me)NHCOCH ₂ O-3-Me-Ph |
| 2236 | H | H | i-Pr | H | H | Ph | 4-cycloPrNHCOCH ₂ CH ₂ O-Ph |
| 2237 | H | H | i-Pr | H | H | Ph | 4-cycloPentylNHCOCH ₂ CH ₂ O-Ph |
| 2238 | H | H | i-Pr | H | H | Ph | 3-I-4-n-PrNHCOCH ₂ CH ₂ O-Ph |
| 2239 | H | H | i-Pr | H | H | Ph | 3-I-4-i-PrNHCOCH ₂ CH ₂ O-Ph |
| 2240 | H | H | i-Pr | H | H | Ph | 4-EtNHCOCH ₂ CH ₂ O-3-I-Ph |
| 2241 | H | H | i-Pr | H | H | Ph | 4-EtCH(Me)NHCOCH ₂ CH ₂ O-3-I-Ph |
| 2242 | H | H | i-Pr | H | H | Ph | 4-EtCOCH ₂ CH ₂ O-3-I-Ph |
| 2243 | H | H | i-Pr | H | H | Ph | 4-cycloPrNHCOCH ₂ CH ₂ O-3-I-Ph |
| 2244 | H | H | i-Pr | H | H | Ph | 4-cycloPentylNHCOCH ₂ CH ₂ O-3-I-Ph |
| 2245 | H | H | i-Pr | H | H | Ph | 3-F-4-n-PrNHCOCH ₂ CH ₂ O-Ph |
| 2246 | H | H | i-Pr | H | H | Ph | 3-F-4-i-PrNHCOCH ₂ CH ₂ O-Ph |
| 2247 | H | H | i-Pr | H | H | Ph | 4-EtNHCOCH ₂ CH ₂ O-3-F-Ph |
| 2248 | H | H | i-Pr | H | H | Ph | 4-EtCH(Me)NHCOCH ₂ CH ₂ O-3-F-Ph |
| 2249 | H | H | i-Pr | H | H | Ph | 4-EtCOCH ₂ CH ₂ O-3-F-Ph |
| 2250 | H | H | i-Pr | H | H | Ph | 3-F-4-i-BuNHCOCH ₂ CH ₂ O-Ph |
| 2251 | H | H | i-Pr | H | H | Ph | 4-cycloPrNHCOCH ₂ CH ₂ O-3-F-Ph |
| 2252 | H | H | i-Pr | H | H | Ph | 3-Br-4-n-PrNHCOCH ₂ CH ₂ O-Ph |
| 2253 | H | H | i-Pr | H | H | Ph | 3-Br-4-i-PrNHCOCH ₂ CH ₂ O-Ph |
| 2254 | H | H | i-Pr | H | H | Ph | 3-Br-4-EtNHCOCH ₂ CH ₂ O-Ph |
| 2255 | H | H | i-Pr | H | H | Ph | 3-Br-4-i-BuNHCOCH ₂ CH ₂ O-Ph |
| 2256 | H | H | i-Pr | H | H | Ph | 3-Cl-4-n-PrNHCOCH ₂ CH ₂ O-Ph |

| | | | | | | | |
|------|---|---|------|---|---|----|---|
| 2257 | H | H | i-Pr | H | H | Ph | 3-Cl-4-i-PrNHCOCH ₂ CH ₂ O-Ph |
| 2258 | H | H | i-Pr | H | H | Ph | 3-Cl-4-EtNHCOCH ₂ CH ₂ O-Ph |
| 2259 | H | H | i-Pr | H | H | Ph | 3-Cl-4-EtCH(Me)NHCOCH ₂ CH ₂ O-Ph |
| 2260 | H | H | i-Pr | H | H | Ph | 3-Cl-4-cycloPrNHCOCH ₂ CH ₂ O-Ph |
| 2261 | H | H | i-Pr | H | H | Ph | 3-Cl-4-cycloPentyNHCOCH ₂ CH ₂ O-Ph |
| 2262 | H | H | i-Pr | H | H | Ph | 3-Me-4-n-PrNHCOCH ₂ CH ₂ O-Ph |
| 2263 | H | H | i-Pr | H | H | Ph | 4-i-PrNHCOCH ₂ CH ₂ O-3-Me-Ph |
| 2264 | H | H | i-Pr | H | H | Ph | 4-EtNHCOCH ₂ CH ₂ O-3-Me-Ph |
| 2265 | H | H | i-Pr | H | H | Ph | 3-Me-4-MeNHCOCH ₂ CH ₂ O-Ph |
| 2266 | H | H | i-Pr | H | H | Ph | 3-Me-4-n-BuNHCOCH ₂ CH ₂ O-Ph |
| 2267 | H | H | i-Pr | H | H | Ph | 4-EtCH(Me)NHCOCH ₂ CH ₂ O-3-Me-Ph |
| 2268 | H | H | i-Pr | H | H | Ph | 4-EtCOCH ₂ CH ₂ O-3-Me-Ph |
| 2269 | H | H | i-Pr | H | H | Ph | 4-i-BuNHCOCH ₂ CH ₂ O-3-Me-Ph |
| 2270 | H | H | i-Pr | H | H | Ph | 3-Me-4-t-BuNHCOCH ₂ CH ₂ O-Ph |
| 2271 | H | H | i-Pr | H | H | Ph | 4-cycloPrNHCOCH ₂ CH ₂ O-3-Me-Ph |
| 2272 | H | H | i-Pr | H | H | Ph | 4-cycloPentyNHCOCH ₂ CH ₂ O-3-Me-Ph |
| 2273 | H | H | Me | H | H | Ph | 3-Cl-4-n-PrNHCOCH ₂ O-Ph |
| 2274 | H | H | Me | H | H | Ph | 3-Cl-4-i-PrNHCOCH ₂ O-Ph |
| 2275 | H | H | Me | H | H | Ph | 3-Cl-4-EtNHCOCH ₂ O-Ph |
| 2276 | H | H | Me | H | H | Ph | 3-Cl-4-EtCH(Me)NHCOCH ₂ O-Ph |
| 2277 | H | H | Me | H | H | Ph | 3-Cl-4-cycloPrNHCOCH ₂ O-Ph |
| 2278 | H | H | Me | H | H | Ph | 3-Cl-4-cycloPentyNHCOCH ₂ O-Ph |
| 2279 | H | H | Et | H | H | Ph | 3-Me-4-n-PrNHCOCH ₂ O-Ph |

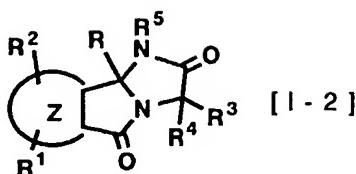
(表17)



| 化合物例 | R ¹ | R ² | R ³ | R ⁴ | R ⁵ | Z | R |
|------|----------------|----------------|----------------|----------------|----------------|----|---|
| 2280 | H | H | Et | H | H | Ph | 4-i-PrNHCOCH ₂ O-3-Me-Ph |
| 2281 | H | H | Et | H | H | Ph | 4-EtNHCOCH ₂ O-3-Me-Ph |
| 2282 | H | H | Et | H | H | Ph | 3-Me-4-MeNHCOCH ₂ O-Ph |
| 2283 | H | H | Et | H | H | Ph | 3-Me-4-n-BuNHCOCH ₂ O-Ph |
| 2284 | H | H | Et | H | H | Ph | 4-EtCH(Me)NHCOCH ₂ O-3-Me-Ph |
| 2285 | H | H | Et | H | H | Ph | 4-EtCOCH ₂ O-3-Me-Ph |
| 2286 | H | H | Et | H | H | Ph | 4-i-BuNHCOCH ₂ O-3-Me-Ph |
| 2287 | H | H | Pr | H | H | Ph | 3-Cl-4-n-PrNHCOCH ₂ O-Ph |
| 2288 | H | H | Pr | H | H | Ph | 3-Cl-4-i-PrNHCOCH ₂ O-Ph |
| 2289 | H | H | Pr | H | H | Ph | 3-Cl-4-EtNHCOCH ₂ O-Ph |
| 2290 | H | H | Pr | H | H | Ph | 3-Cl-4-EtCH(Me)NHCOCH ₂ O-Ph |
| 2291 | H | H | Pr | H | H | Ph | 3-Cl-4-cycloPrNHCOCH ₂ O-Ph |
| 2292 | H | H | Pr | H | H | Ph | 3-Cl-4-cycloPentyNHCOCH ₂ O-Ph |
| 2293 | H | H | Bu | H | H | Ph | 3-Me-4-n-PrNHCOCH ₂ O-Ph |
| 2294 | H | H | Bu | H | H | Ph | 4-i-PrNHCOCH ₂ O-3-Me-Ph |
| 2295 | H | H | Bu | H | H | Ph | 4-EtNHCOCH ₂ O-3-Me-Ph |
| 2296 | H | H | Bu | H | H | Ph | 3-Me-4-MeNHCOCH ₂ O-Ph |
| 2297 | H | H | Bu | H | H | Ph | 3-Me-4-n-BuNHCOCH ₂ O-Ph |
| 2298 | H | H | Bu | H | H | Ph | 4-EtCH(Me)NHCOCH ₂ O-3-Me-Ph |
| 2299 | H | H | Bu | H | H | Ph | 4-EtCOCH ₂ O-3-Me-Ph |
| 2300 | H | H | Bu | H | H | Ph | 4-i-BuNHCOCH ₂ O-3-Me-Ph |
| 2301 | H | H | i-Bu | H | H | Ph | 3-Cl-4-n-PrNHCOCH ₂ O-Ph |
| 2302 | H | H | i-Bu | H | H | Ph | 3-Cl-4-i-PrNHCOCH ₂ O-Ph |
| 2303 | H | H | i-Bu | H | H | Ph | 3-Cl-4-EtNHCOCH ₂ O-Ph |

| | | | | | | | |
|------|---|---|-------------------|----|---|-------------|--|
| 2304 | H | H | i-Bu | H | H | Ph | 3-Cl-4-EtCH(Me)NHCOCH ₂ O-Ph |
| 2305 | H | H | i-Bu | H | H | Ph | 3-Cl-4-cycloPrNHCOCH ₂ O-Ph |
| 2306 | H | H | i-Bu | H | H | Ph | 3-Cl-4-cycloPentylNHCOCH ₂ O-Ph |
| 2307 | H | H | t-Bu | H | H | Ph | 3-Me-4-n-PrNHCOCH ₂ O-Ph |
| 2308 | H | H | t-Bu | H | H | Ph | 4-i-PrNHCOCH ₂ O-3-Me-Ph |
| 2309 | H | H | t-Bu | H | H | Ph | 4-EtNHCOCH ₂ O-3-Me-Ph |
| 2310 | H | H | t-Bu | H | H | Ph | 3-Me-4-MeNHCOCH ₂ O-Ph |
| 2311 | H | H | PhCH ₂ | H | H | Ph | 3-Me-4-n-BuNHCOCH ₂ O-Ph |
| 2312 | H | H | PhCH ₂ | H | H | Ph | 4-EtCH(Me)NHCOCH ₂ O-3-Me-Ph |
| 2313 | H | H | PhCH ₂ | H | H | Ph | 4-EtCOCH ₂ O-3-Me-Ph |
| 2314 | H | H | PhCH ₂ | H | H | Ph | 4-i-BuNHCOCH ₂ O-3-Me-Ph |
| 2315 | H | H | i-Pr | Me | H | Ph | 3-Cl-4-n-PrNHCOCH ₂ O-Ph |
| 2316 | H | H | i-Pr | Me | H | Ph | 3-Cl-4-i-PrNHCOCH ₂ O-Ph |
| 2317 | H | H | i-Pr | Me | H | Ph | 3-Cl-4-EtNHCOCH ₂ O-Ph |
| 2318 | H | H | i-Pr | Me | H | Ph | 3-Cl-4-EtCH(Me)NHCOCH ₂ O-Ph |
| 2319 | H | H | i-Pr | Me | H | Ph | 3-Cl-4-cycloPrNHCOCH ₂ O-Ph |
| 2320 | H | H | i-Pr | Me | H | Ph | 3-Cl-4-cycloPentylNHCOCH ₂ O-Ph |
| 2321 | H | H | i-Pr | H | H | 2,3-Pyridyl | 3-Me-4-n-PrNHCOCH ₂ O-Ph |
| 2322 | H | H | i-Pr | H | H | 2,3-Pyridyl | 4-i-PrNHCOCH ₂ O-3-Me-Ph |
| 2323 | H | H | i-Pr | H | H | 2,3-Pyridyl | 4-EtNHCOCH ₂ O-3-Me-Ph |
| 2324 | H | H | i-Pr | H | H | 2,3-Pyridyl | 3-Me-4-MeNHCOCH ₂ O-Ph |
| 2325 | H | H | i-Pr | H | H | 2,3-Pyridyl | 3-Me-4-n-BuNHCOCH ₂ O-Ph |

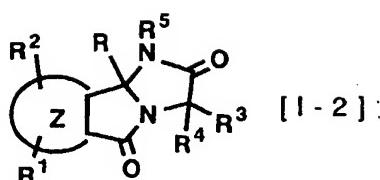
(表18)



| 化合物例 | R ¹ | R ² | R ³ | R ⁴ | R ⁵ | Z | R |
|------|----------------|----------------|----------------|----------------|----------------|-------------|---|
| 2326 | H | H | i-Pr | H | H | 2,3-Pyridyl | 4-EtCH(Me)NHCOCH ₂ O-3-Me-Ph |
| 2327 | H | H | i-Pr | H | H | 2,3-Pyridyl | 4-EtCOCH ₂ O-3-Me-Ph |
| 2328 | H | H | i-Pr | H | H | 2,3-Pyridyl | 4-i-BuNHCOCH ₂ O-3-Me-Ph |
| 2329 | H | H | i-Pr | H | H | 2,3-Pyridyl | 3-Cl-4-n-PrNHCOCH ₂ O-Ph |
| 2330 | H | H | i-Pr | H | H | 3,4-Pyridyl | 3-Cl-4-i-PrNHCOCH ₂ O-Ph |
| 2331 | H | H | i-Pr | H | H | 3,4-Pyridyl | 3-Cl-4-EtNHCOCH ₂ O-Ph |
| 2332 | H | H | i-Pr | H | H | 3,4-Pyridyl | 3-Cl-4-EtCH(Me)NHCOCH ₂ O-Ph |
| 2333 | H | H | i-Pr | H | H | 3,4-Pyridyl | 3-Cl-4-cycloPrNHCOCH ₂ O-Ph |
| 2334 | H | H | i-Pr | H | H | 3,4-Pyridyl | 3-Cl-4-cycloPentyNHCOCH ₂ O-Ph |
| 2335 | H | H | i-Pr | H | H | Ph | 4-F-5-n-PrNHCOCH ₂ O-(2-pyridyl) |
| 2336 | H | H | i-Pr | H | H | Ph | 4-F-5-i-PrNHCOCH ₂ O-(2-pyridyl) |
| 2337 | H | H | i-Pr | H | H | Ph | 4-EtNHCOCH ₂ O-3-F-(2-pyridyl) |
| 2338 | H | H | i-Pr | H | H | Ph | 4-EtCH(Me)NHCOCH ₂ O-3-F-(2-pyridyl) |
| 2339 | H | H | i-Pr | H | H | Ph | 4-EtCOCH ₂ O-3-F-(2-pyridyl) |
| 2340 | H | H | i-Pr | H | H | Ph | 3-F-4-i-BuNHCOCH ₂ O-(2-pyridyl) |
| 2341 | H | H | i-Pr | H | H | Ph | 4-cycloPrNHCOCH ₂ O-3-F-(2-pyridyl) |
| 2342 | H | H | i-Pr | H | H | Ph | 5-I-6-n-PrNHCOCH ₂ O-(3-pyridyl) |
| 2343 | H | H | i-Pr | H | H | Ph | 5-I-6-i-PrNHCOCH ₂ O-(3-pyridyl) |
| 2344 | H | H | i-Pr | H | H | Ph | 6-EtNHCOCH ₂ O-5-I-(3-pyridyl) |
| 2345 | H | H | i-Pr | H | H | Ph | 6-EtCH(Me)NHCOCH ₂ O-5-I-(3-pyridyl) |
| 2346 | H | H | i-Pr | H | H | Ph | 6-EtCOCH ₂ O-5-I-(3-pyridyl) |
| 2347 | H | H | i-Pr | H | H | Ph | 6-cycloPrNHCOCH ₂ O-5-I-(3-pyridyl) |
| 2348 | H | H | i-Pr | H | H | Ph | 3-NO ₂ -4-n-PrNHCOCH ₂ O-Ph |
| 2349 | H | H | i-Pr | H | H | Ph | 3-NO ₂ -4-i-PrNHCOCH ₂ O-Ph |

| | | | | | | | |
|------|---|---|------|---|---|----|---|
| 2350 | H | H | i-Pr | H | H | Ph | 4-EtNHC ₂ O-3-NO ₂ -Ph |
| 2351 | H | H | i-Pr | H | H | Ph | 4-EtCH(Me)NHC ₂ O-3-NO ₂ -Ph |
| 2352 | H | H | i-Pr | H | H | Ph | 4-EtCOCH ₂ O-3-NO ₂ -Ph |
| 2353 | H | H | i-Pr | H | H | Ph | 4-i-BuNHCOCH ₂ O-3-NO ₂ -Ph |
| 2354 | H | H | i-Pr | H | H | Ph | 4-cycloPrNHCOCH ₂ O-3-NO ₂ -Ph |
| 2355 | H | H | i-Pr | H | H | Ph | 3-MeO-4-n-PrNHC ₂ O-Ph |
| 2356 | H | H | i-Pr | H | H | Ph | 3-MeO-4-i-PrNHC ₂ O-Ph |
| 2357 | H | H | i-Pr | H | H | Ph | 4-EtNHC ₂ O-3-MeO-Ph |
| 2358 | H | H | i-Pr | H | H | Ph | 4-EtCH(Me)NHC ₂ O-3-MeO-Ph |
| 2359 | H | H | i-Pr | H | H | Ph | 4-EtCOCH ₂ O-3-MeO-Ph |
| 2360 | H | H | i-Pr | H | H | Ph | 3-MeO-4-i-BuNHCOCH ₂ O-Ph |
| 2361 | H | H | i-Pr | H | H | Ph | 4-cycloPrNHCOCH ₂ O-3-MeO-Ph |
| 2362 | H | H | i-Pr | H | H | Ph | 3-HO-4-n-PrNHC ₂ O-Ph |
| 2363 | H | H | i-Pr | H | H | Ph | 3-HO-4-i-PrNHC ₂ O-Ph |
| 2364 | H | H | i-Pr | H | H | Ph | 4-EtNHC ₂ O-3-HO-Ph |
| 2365 | H | H | i-Pr | H | H | Ph | 4-EtCH(Me)NHC ₂ O-3-HO-Ph |
| 2366 | H | H | i-Pr | H | H | Ph | 4-EtCOCH ₂ O-3-HO-Ph |
| 2367 | H | H | i-Pr | H | H | Ph | 3-HO-4-i-BuNHCOCH ₂ O-Ph |
| 2368 | H | H | i-Pr | H | H | Ph | 4-cycloPrNHCOCH ₂ O-3-HO-Ph |
| 2369 | H | H | i-Pr | H | H | Ph | 3-H ₂ NCH ₂ CH ₂ NHC ₂ O-Ph |
| 2370 | H | H | i-Pr | H | H | Ph | 2-H ₂ NCH ₂ CH ₂ NHC ₂ O-Ph |
| 2371 | H | H | i-Pr | H | H | Ph | 4-MeNHCH ₂ CH ₂ NHC ₂ O-Ph |

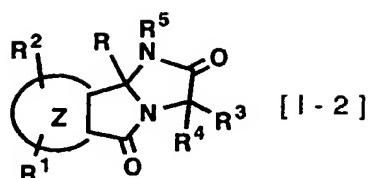
(表19)



| 化合物例 | R ¹ | R ² | R ³ | R ⁴ | R ⁵ | Z | R |
|------|----------------|----------------|----------------|----------------|----------------|----|---|
| 2372 | H | H | i-Pr | H | H | Ph | 3-MeNHCH ₂ CH ₂ NHCOCH ₂ O-Ph |
| 2373 | H | H | i-Pr | H | H | Ph | 2-MeNHCH ₂ CH ₂ NHCOCH ₂ O-Ph |
| 2374 | H | H | i-Pr | H | H | Ph | 4-Me ₂ NCH ₂ CH ₂ NHCOCH ₂ O-Ph |
| 2375 | H | H | i-Pr | H | H | Ph | 3-Me ₂ NCH ₂ CH ₂ NHCOCH ₂ O-Ph |
| 2376 | H | H | i-Pr | H | H | Ph | 2-Me ₂ NCH ₂ CH ₂ NHCOCH ₂ O-Ph |
| 2377 | H | H | i-Pr | H | H | Ph | 4-H ₂ NCH ₂ CH ₂ NHCOCH ₂ O-3-Cl-Ph |
| 2378 | H | H | i-Pr | H | H | Ph | 3-H ₂ NCH ₂ CH ₂ NHCOCH ₂ O-4-Cl-Ph |
| 2379 | H | H | i-Pr | H | H | Ph | 2-H ₂ NCH ₂ CH ₂ NHCOCH ₂ O-4-Cl-Ph |
| 2380 | H | H | i-Pr | H | H | Ph | 4-MeNHCH ₂ CH ₂ NHCOCH ₂ O-3-Me-Ph |
| 2381 | H | H | i-Pr | H | H | Ph | 3-MeNHCH ₂ CH ₂ NHCOCH ₂ O-4-Me-Ph |
| 2382 | H | H | i-Pr | H | H | Ph | 2-MeNHCH ₂ CH ₂ NHCOCH ₂ O-4-MePh |
| 2383 | H | H | i-Pr | H | H | Ph | 4-Me ₂ NCH ₂ CH ₂ NHCOCH ₂ O-3-F-Ph |
| 2384 | H | H | i-Pr | H | H | Ph | 3-Me ₂ NCH ₂ CH ₂ NHCOCH ₂ O-4-F-Ph |
| 2385 | H | H | i-Pr | H | H | Ph | 2-Me ₂ NCH ₂ CH ₂ NHCOCH ₂ O-4-F-Ph |
| 2386 | H | H | i-Pr | H | H | Ph | 4-H ₂ NCOCH ₂ -3-I-Ph |
| 2387 | H | H | i-Pr | H | H | Ph | 3-I-4-MeNHCOCH ₂ -Ph |
| 2388 | H | H | i-Pr | H | H | Ph | 4-EtNHCOCH ₂ -3-I-Ph |
| 2389 | H | H | i-Pr | H | H | Ph | 3-I-4-nPrNHCOCH ₂ -Ph |
| 2390 | H | H | i-Pr | H | H | Ph | 3-I-4-iPrNHCOCH ₂ -Ph |
| 2391 | H | H | i-Pr | H | H | Ph | 4-nBuNHCOCH ₂ -3-I-Ph |
| 2392 | H | H | i-Pr | H | H | Ph | 4-tBuNHCOCH ₂ -3-I-Ph |
| 2393 | H | H | i-Pr | H | H | Ph | 4-iBuNHCOCH ₂ -Ph |
| 2394 | H | H | i-Pr | H | H | Ph | 4-tBuO ₂ CCH ₂ -3-I-Ph |

| | | | | | | | |
|------|---|---|------|---|----|----|--|
| 2395 | H | H | i-Pr | H | H | Ph | 3-I-4-PhCH ₂ NHCOCH ₂ -Ph |
| 2396 | H | H | i-Pr | H | H | Ph | 3-I-4-(2-tetrahydrofuryl)CH ₂ NHCOCH ₂ -Ph |
| 2397 | H | H | i-Pr | H | H | Ph | 4-cycloPrNHCOCH ₂ -3-I-Ph |
| 2398 | H | H | i-Pr | H | H | Ph | 4-cycloPentyNHCOCH ₂ -3-I-Ph |
| 2399 | H | H | i-Pr | H | H | Ph | 4-cycloHexylNHCOCH ₂ -3-I-Ph |
| 2400 | H | H | i-Pr | H | H | Ph | 4-cycloPrNHCOCH ₂ -3-F-Ph |
| 2401 | H | H | i-Pr | H | H | Ph | 3-Cl-4-i-PrNHCOCH ₂ CH ₂ -Ph |
| 2402 | H | H | i-Pr | H | H | Ph | 3-Cl-4-EtNHCOCH ₂ CH ₂ -Ph |
| 2403 | H | H | i-Pr | H | H | Ph | 3-Cl-4-EtCH(Me)NHCOCH ₂ CH ₂ -Ph |
| 2404 | H | H | i-Pr | H | H | Ph | 4-i-PrNHCO-3-Me-Ph |
| 2405 | H | H | i-Pr | H | H | Ph | 4-EtNHCO-3-Me-Ph |
| 2406 | H | H | i-Pr | H | H | Ph | 4-EtCH(Me)NHCO-3-Me-Ph |
| 2407 | H | H | i-Pr | H | H | Ph | 3-Cl-4-i-PrNHCH ₂ CH ₂ O-Ph |
| 2408 | H | H | i-Pr | H | H | Ph | 3-Cl-4-EtNHCH ₂ CH ₂ O-Ph |
| 2409 | H | H | i-Pr | H | H | Ph | 3-Cl-4-EtCH(Me)NHCH ₂ CH ₂ O-Ph |
| 2410 | H | H | i-Pr | H | Me | Ph | 3-Cl-4-n-PrNHCOCH ₂ O-Ph |
| 2411 | H | H | i-Pr | H | Me | Ph | 3-Cl-4-i-PrNHCOCH ₂ O-Ph |
| 2412 | H | H | i-Pr | H | Me | Ph | 3-Cl-4-EtNHCOCH ₂ O-Ph |
| 2413 | H | H | i-Pr | H | Me | Ph | 3-Cl-4-EtCH(Me)NHCOCH ₂ O-Ph |
| 2414 | H | H | i-Pr | H | Me | Ph | 3-Cl-4-cycloPrNHCOCH ₂ O-Ph |
| 2415 | H | H | i-Pr | H | Me | Ph | 3-Cl-4-cycloPentyNHCOCH ₂ O-Ph |
| 2416 | H | H | i-Pr | H | Et | Ph | 3-Me-4-n-PrNHCOCH ₂ O-Ph |
| 2417 | H | H | i-Pr | H | Et | Ph | 4-i-PrNHCOCH ₂ O-3-Me-Ph |

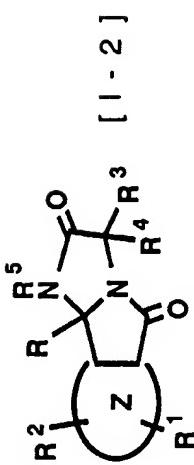
(表20)



| 化合物例 | R¹ | R² | R³ | R⁴ | R⁵ | Z | R |
|------|---------------|---------------|---------------|---------------|---------------|----|--|
| 2418 | H | H | i-Pr | H | Et | Ph | 4-EtNHCOCH₂O-3-Me-Ph |
| 2419 | H | H | i-Pr | H | Et | Ph | 3-Me-4-MeNHCOCH₂O-Ph |
| 2420 | H | H | i-Pr | H | Et | Ph | 3-Me-4-n-BuNHCOCH₂O-Ph |
| 2421 | H | H | i-Pr | H | Et | Ph | 4-EtCH(Me)NHCOCH₂O-3-Me-Ph |
| 2422 | H | H | i-Pr | H | Et | Ph | 4-EtCOCH₂O-3-Me-Ph |
| 2423 | H | H | i-Pr | H | Et | Ph | 4-i-BuNHCOCH₂O-3-Me-Ph |
| 2424 | H | H | i-Pr | H | Ac | Ph | 3-Cl-4-n-PrNHCOCH₂O-Ph |
| 2425 | H | H | i-Pr | H | Ac | Ph | 3-Cl-4-i-PrNHCOCH₂O-Ph |
| 2426 | H | H | i-Pr | H | Ac | Ph | 3-Cl-4-EtNHCOCH₂O-Ph |
| 2427 | H | H | i-Pr | H | Ac | Ph | 3-Cl-4-EtCH(Me)NHCOCH₂O-Ph |
| 2428 | H | H | i-Pr | H | Ac | Ph | 3-Cl-4-cycloPrNHCOCH₂O-Ph |
| 2429 | H | H | i-Pr | H | Ac | Ph | 3-Cl-4-cycloPentylNHCOCH₂O-Ph |
| 2430 | H | H | i-Pr | H | OH | Ph | 3-Me-4-n-PrNHCOCH₂O-Ph |
| 2431 | H | H | i-Pr | H | OH | Ph | 4-i-PrNHCOCH₂O-3-Me-Ph |
| 2432 | H | H | i-Pr | H | OH | Ph | 4-EtNHCOCH₂O-3-Me-Ph |
| 2433 | H | H | i-Pr | H | OH | Ph | 3-Me-4-MeNHCOCH₂O-Ph |
| 2434 | H | H | i-Pr | H | OH | Ph | 3-Me-4-n-BuNHCOCH₂O-Ph |
| 2435 | H | H | i-Pr | H | OH | Ph | 4-EtCH(Me)NHCOCH₂O-3-Me-Ph |
| 2436 | H | H | i-Pr | H | OH | Ph | 4-EtCOCH₂O-3-Me-Ph |
| 2437 | H | H | i-Pr | H | OH | Ph | 4-i-BuNHCOCH₂O-3-Me-Ph |
| 2438 | H | H | i-Pr | H | OMe | Ph | 3-Cl-4-n-PrNHCOCH₂O-Ph |
| 2439 | H | H | i-Pr | H | OMe | Ph | 3-Cl-4-i-PrNHCOCH₂O-Ph |
| 2440 | H | H | i-Pr | H | OMe | Ph | 3-Cl-4-EtNHCOCH₂O-Ph |

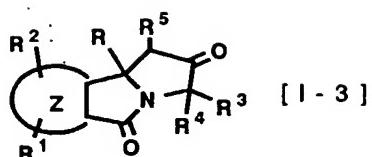
| | | | | | | | |
|------|---|---|------|---|------|----|---|
| 2441 | H | H | i-Pr | H | OMe | Ph | 3-Cl-4-EtCH(Me)NHCOCH ₂ O-Ph |
| 2442 | H | H | i-Pr | H | OMe | Ph | 3-Cl-4-cycloPrNHCOCH ₂ O-Ph |
| 2443 | H | H | i-Pr | H | OMe | Ph | 3-Cl-4-cycloPentyNHCOCH ₂ O-Ph |
| 2444 | H | H | i-Pr | H | OEt | Ph | 3-Me-4-n-PrNHCOCH ₂ O-Ph |
| 2445 | H | H | i-Pr | H | OEt | Ph | 4-i-PrNHCOCH ₂ O-3-Me-Ph |
| 2446 | H | H | i-Pr | H | OEt | Ph | 4-EtNHCOCH ₂ O-3-Me-Ph |
| 2447 | H | H | i-Pr | H | OEt | Ph | 3-Me-4-MeNHCOCH ₂ O-Ph |
| 2448 | H | H | i-Pr | H | OEt | Ph | 3-Me-4-n-BuNHCOCH ₂ O-Ph |
| 2449 | H | H | i-Pr | H | OEt | Ph | 4-EtCH(Me)NHCOCH ₂ O-3-Me-Ph |
| 2450 | H | H | i-Pr | H | OEt | Ph | 4-EtCOCH ₂ O-3-Me-Ph |
| 2451 | H | H | i-Pr | H | OEt | Ph | 4-i-BuNHCOCH ₂ O-3-Me-Ph |
| 2452 | H | H | i-Pr | H | Pr | Ph | 3-Cl-4-n-PrNHCOCH ₂ O-Ph |
| 2453 | H | H | i-Pr | H | Pr | Ph | 3-Cl-4-i-PrNHCOCH ₂ O-Ph |
| 2454 | H | H | i-Pr | H | Pr | Ph | 3-Cl-4-EtNHCOCH ₂ O-Ph |
| 2455 | H | H | i-Pr | H | Pr | Ph | 3-Cl-4-EtCH(Me)NHCOCH ₂ O-Ph |
| 2456 | H | H | i-Pr | H | Pr | Ph | 3-Cl-4-cycloPrNHCOCH ₂ O-Ph |
| 2457 | H | H | i-Pr | H | Pr | Ph | 3-Cl-4-cycloPentyNHCOCH ₂ O-Ph |
| 2458 | H | H | i-Pr | H | i-Pr | Ph | 3-Me-4-n-PrNHCOCH ₂ O-Ph |
| 2459 | H | H | i-Pr | H | i-Pr | Ph | 4-i-PrNHCOCH ₂ O-3-Me-Ph |
| 2460 | H | H | i-Pr | H | i-Pr | Ph | 4-EtNHCOCH ₂ O-3-Me-Ph |
| 2461 | H | H | i-Pr | H | i-Pr | Ph | 3-Me-4-MeNHCOCH ₂ O-Ph |
| 2462 | H | H | i-Pr | H | i-Pr | Ph | 3-Me-4-n-BuNHCOCH ₂ O-Ph |
| 2463 | H | H | i-Pr | H | i-Pr | Ph | 4-EtCH(Me)NHCOCH ₂ O-3-Me-Ph |

(表21)



| 化合物例 | R ¹ | R ² | R ³ | R ⁴ | R ⁵ | Z | R |
|------|----------------|----------------|---|----------------|---------------------------------------|----------------------|---|
| 2464 | H | H | i-Pr | H | H | 4,5-ethylenedioxy-Ph | 4-nBuNHCOC ₂ O-Ph |
| 2465 | H | H | i-Pr | i-Pr | H | | 3-PhCO ₂ -4-nPrNHCOC ₂ O-Ph |
| 2466 | H | H | i-Pr | i-Pr | H | | 3-cycloPrNH-4-nPrNHCOC ₂ O-Ph |
| 2467 | H | H | i-Pr | i-Pr | H | | 4-nPrNHCOC ₂ O-pyrimidin-5-yl |
| 2468 | H | H | MeSO ₂ NHCH ₂ CH ₂ | H | H | | 4-nPrNHCOC ₂ O-Ph |
| 2469 | H | H | MeOCH ₂ CH ₂ | H | H | | 4-nPrNHCOC ₂ O-Ph |
| 2470 | H | H | MeO ₂ CCH=CH | H | H | | 4-nPrNHCOC ₂ O-Ph |
| 2471 | H | H | i-Pr | H | Me | | 4-nPrNHCOC ₂ O-Ph |
| 2472 | H | H | i-Pr | H | nPrNHCOC ₂ | | 4-nPrNHCOC ₂ O-Ph |
| 2473 | H | H | i-Pr | H | H ₂ NCOCH ₂ | | 4-nPrNHCOC ₂ O-Ph |
| 2474 | H | H | i-Pr | H | MeSO ₂ NHCOCH ₂ | | 4-nPrNHCOC ₂ O-Ph |
| 2475 | H | H | i-Pr | H | MeO ₂ CCH ₂ | | 4-nPrNHCOC ₂ O-Ph |
| 2476 | H | H | i-Pr | H | HOCH ₂ CH ₂ | | 4-nPrNHCOC ₂ O-Ph |

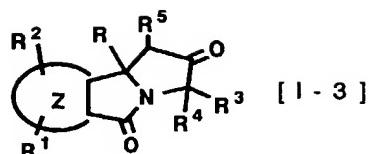
(表22)



| 化合物例 | R ¹ | R ² | R ³ | R ⁴ | R ⁶ | Z | R |
|------|----------------|----------------|----------------|----------------|----------------|----|---|
| 3001 | H | H | i-Pr | H | H | Ph | 2-MeO-Ph |
| 3002 | H | H | i-Pr | H | H | Ph | Ph |
| 3003 | H | H | i-Pr | H | H | Ph | 2-NH ₂ -Ph |
| 3004 | H | H | i-Pr | H | H | Ph | 4-F-Ph |
| 3005 | H | H | i-Pr | H | H | Ph | 4-Et ₂ N-Ph |
| 3006 | H | H | i-Pr | H | H | Ph | 4-Cl-Ph |
| 3007 | H | H | i-Pr | H | H | Ph | 4-HO-Ph |
| 3008 | H | H | i-Pr | H | H | Ph | 3-MeO-Ph |
| 3009 | H | H | i-Pr | H | H | Ph | 3-HO-Ph |
| 3010 | H | H | i-Pr | H | H | Ph | 3-NH ₂ -Ph |
| 3011 | H | H | i-Pr | H | H | Ph | 4-MeO-Ph |
| 3012 | H | H | i-Pr | H | H | Ph | 4-Me-Ph |
| 3013 | H | H | i-Pr | H | H | Ph | 3-Me-Ph |
| 3014 | H | H | i-Pr | H | H | Ph | 4-tBuO ₂ CCH ₂ O-Ph |
| 3015 | H | H | i-Pr | H | H | Ph | 4-HO ₂ CCH ₂ O-Ph |
| 3016 | H | H | i-Pr | H | H | Ph | 4-tBuO ₂ C(CH ₂) ₅ O-Ph |
| 3017 | H | H | i-Pr | H | H | Ph | 4-HO ₂ C(CH ₂) ₅ O-Ph |
| 3018 | H | H | i-Pr | H | H | Ph | 4-HO(CH ₂) ₃ O-Ph |
| 3019 | H | H | i-Pr | H | H | Ph | 4-HO(CH ₂) ₂ O-Ph |
| 3020 | H | H | i-Pr | H | H | Ph | 4-HOC(Me) ₂ (CH ₂) ₂ O-Ph |
| 3021 | H | H | i-Pr | H | H | Ph | 4-PhCH ₂ O-Ph |
| 3022 | H | H | i-Pr | H | H | Ph | 4-MeNHCOCH ₂ O-Ph |
| 3023 | H | H | i-Pr | H | H | Ph | 4-EtNHCOCH ₂ O-Ph |

| | | | | | | | |
|------|---|---|------|---|---|----|---|
| 3024 | H | H | i-Pr | H | H | Ph | 4-nPrNHCOCH ₂ O-Ph |
| 3025 | H | H | i-Pr | H | H | Ph | 4-nBuNHCOCH ₂ O-Ph |
| 3026 | H | H | i-Pr | H | H | Ph | 4-CH ₂ =CHCH ₂ NHCOCH ₂ O-Ph |
| 3027 | H | H | i-Pr | H | H | Ph | 4-Me(CH ₂) ₉ NHCOCH ₂ O-Ph |
| 3028 | H | H | i-Pr | H | H | Ph | 4-N ₃ (CH ₂) ₃ O-Ph |
| 3029 | H | H | i-Pr | H | H | Ph | 4-tBuO ₂ CCH(Me)O-Ph |
| 3030 | H | H | i-Pr | H | H | Ph | 4-nPrNHCOCH(Me)O-Ph |
| 3031 | H | H | i-Pr | H | H | Ph | 4-F ₃ CSO ₃ -Ph |
| 3032 | H | H | i-Pr | H | H | Ph | 4-tBuO ₂ CCH=CHPh |
| 3033 | H | H | i-Pr | H | H | Ph | 4-nPrNHCOCH=CH-Ph |
| 3034 | H | H | i-Pr | H | H | Ph | 4-nPrCH(Me)NHCOCH ₂ O-Ph |
| 3035 | H | H | i-Pr | H | H | Ph | 4-EtCH(Me)NHCOCH ₂ O-Ph |
| 3036 | H | H | i-Pr | H | H | Ph | 4-MeOCH ₂ O-Ph |
| 3037 | H | H | i-Pr | H | H | Ph | 4-EtCOCH ₂ O-Ph |
| 3038 | H | H | i-Pr | H | H | Ph | 3-tBuO ₂ CCH ₂ O-Ph |
| 3039 | H | H | i-Pr | H | H | Ph | 3-HO ₂ CCH ₂ O-Ph |
| 3040 | H | H | i-Pr | H | H | Ph | 3-nPrNHCOCH ₂ O-Ph |
| 3041 | H | H | i-Pr | H | H | Ph | 4-H ₂ NC(Me) ₂ CH ₂ O ₂ CCH ₂ O-Ph |
| 3042 | H | H | i-Pr | H | H | Ph | 4-morpholinoCOCH ₂ O-Ph |
| 3043 | H | H | i-Pr | H | H | Ph | 4-(4-Cl-Ph)-COCH ₂ O-Ph |
| 3044 | H | H | i-Pr | H | H | Ph | 4-PhCOCH ₂ O-Ph |
| 3045 | H | H | i-Pr | H | H | Ph | 4-(4-pyridyl)-CH ₂ NHCOCH ₂ O- |
| 3046 | H | H | i-Pr | H | H | Ph | 4-H ₂ NCH ₂ CH ₂ NHCOCH ₂ O-Ph |
| 3047 | H | H | i-Pr | H | H | Ph | 4-Cl-3-NO ₂ -Ph |

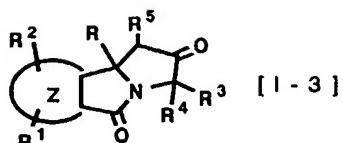
(表23)



| 化合物例 | R ¹ | R ² | R ³ | R ⁴ | R ⁶ | Z | R |
|------|----------------|----------------|----------------|----------------|----------------|--|---|
| 3048 | H | H | i-Pr | H | H | Ph 4-Cl-3-F-Ph | |
| 3049 | H | H | i-Pr | H | H | Ph 4-Cl-3-Me-Ph | |
| 3050 | H | H | i-Pr | H | H | Ph 3-NH ₂ -4-Cl-Ph | |
| 3051 | H | H | i-Pr | H | H | Ph 3-Cl-4-MeO-Ph | |
| 3052 | H | H | i-Pr | H | H | Ph 3-Cl-4-Me-Ph | |
| 3053 | H | H | i-Pr | H | H | Ph 4-Br-3-Cl-Ph | |
| 3054 | H | H | i-Pr | H | H | Ph 4-Br-2-Cl-Ph | |
| 3055 | H | H | i-Pr | H | H | Ph 4-F-3-Me-Ph | |
| 3056 | H | H | i-Pr | H | H | Ph 3-F-4-Me-Ph | |
| 3057 | H | H | i-Pr | H | H | Ph 3-Br-4-HO-Ph | |
| 3058 | H | H | i-Pr | H | H | Ph 3-Br-4-MeO-Ph | |
| 3059 | H | H | i-Pr | H | H | Ph 3-Br-4-F-Ph | |
| 3060 | H | H | i-Pr | H | H | Ph 3-F-4-PhPh | |
| 3061 | H | H | i-Pr | H | H | Ph 4-HO-3-I-Ph | |
| 3062 | H | H | i-Pr | H | H | Ph 5-HO-2-I-Ph | |
| 3063 | H | H | i-Pr | H | H | Ph 3-I-4-MeO-Ph | |
| 3064 | H | H | i-Pr | H | H | Ph 2-I-5-MeO-Ph | |
| 3065 | H | H | i-Pr | H | H | Ph 4-MeO-3-Me-Ph | |
| 3066 | H | H | i-Pr | H | H | Ph 4-HO(CH ₂) ₃ O-3-I-Ph | |
| 3067 | H | H | i-Pr | H | H | Ph 4-HO(CH ₂) ₂ O-3-I-Ph | |
| 3068 | H | H | i-Pr | H | H | Ph 4-HOC(Me) ₂ (CH ₂) ₂ O-3-I-Ph | |
| 3069 | H | H | i-Pr | H | H | Ph 4-tBuO ₂ C(CH ₂) ₄ O-3-I-Ph | |
| 3070 | H | H | i-Pr | H | H | Ph 3-I-4-PhCH ₂ O-Ph | |

| | | | | | | | |
|------|---|---|------|---|---|----|---|
| 3071 | H | H | i-Pr | H | H | Ph | 4-H ₂ NCOCH ₂ O-3-I-Ph |
| 3072 | H | H | i-Pr | H | H | Ph | 3-I-4-MeNHCOCH ₂ O-Ph |
| 3073 | H | H | i-Pr | H | H | Ph | 4-EtNHCOCH ₂ O-3-I-Ph |
| 3074 | H | H | i-Pr | H | H | Ph | 3-I-4-nPrNHCOCH ₂ O-Ph |
| 3075 | H | H | i-Pr | H | H | Ph | 3-I-4-iPrNHCOCH ₂ O-Ph |
| 3076 | H | H | i-Pr | H | H | Ph | 4-nBuNHCOCH ₂ O-3-I-Ph |
| 3077 | H | H | i-Pr | H | H | Ph | 4-tBuNHCOCH ₂ O-3-I-Ph |
| 3078 | H | H | i-Pr | H | H | Ph | 4-iBuNHCOCH ₂ O-Ph |
| 3079 | H | H | i-Pr | H | H | Ph | 4-tBuO ₂ CCH ₂ O-3-I-Ph |
| 3080 | H | H | i-Pr | H | H | Ph | 3-I-4-PhCH ₂ NHCOCH ₂ O-Ph |
| 3081 | H | H | i-Pr | H | H | Ph | 3-I-4-(2-tetrahydrofuryl)CH ₂ NHCOCH ₂ O-Ph |
| 3082 | H | H | i-Pr | H | H | Ph | 4-cycloPrNHCOCH ₂ O-3-I-Ph |
| 3083 | H | H | i-Pr | H | H | Ph | 4-cycloPentyNHCOCH ₂ O-3-I-Ph |
| 3084 | H | H | i-Pr | H | H | Ph | 4-cycloHexylNHCOCH ₂ O-3-I-Ph |
| 3085 | H | H | i-Pr | H | H | Ph | 4-cycloPrNHCOCH ₂ O-3-F-Ph |
| 3086 | H | H | i-Pr | H | H | Ph | 4-Me(CH ₂) ₉ NHCOCH ₂ O-3-I-Ph |
| 3087 | H | H | i-Pr | H | H | Ph | 4-HO ₂ CCH ₂ O-3-I-Ph |
| 3088 | H | H | i-Pr | H | H | Ph | 4-N ₃ (CH ₂) ₃ O-3-I-Ph |
| 3089 | H | H | i-Pr | H | H | Ph | 3-I-4-nPrNHCO(CH ₂) ₄ O-Ph |
| 3090 | H | H | i-Pr | H | H | Ph | 4-Et ₂ NCOCH ₂ O-3-I-Ph |
| 3091 | H | H | i-Pr | H | H | Ph | 3-I-4-nPrN(Me)COCH ₂ O-Ph |
| 3092 | H | H | i-Pr | H | H | Ph | 3-Cl-4-nPrNHCOCH ₂ O-Ph |
| 3093 | H | H | i-Pr | H | H | Ph | 3-Br-4-nPrNHCOCH ₂ O-Ph |
| 3094 | H | H | i-Pr | H | H | Ph | 3-F-4-nPrNHCOCH ₂ O-Ph |

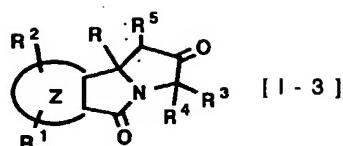
(表24)



| 化合物例 | R ¹ | R ² | R ³ | R ⁴ | R ⁶ | Z | R |
|------|----------------|----------------|----------------|----------------|----------------|--|---|
| 3095 | H | H | i-Pr | H | H | Ph 3-Me-4-nPrNHC ₂ O-Ph | |
| 3096 | H | H | i-Pr | H | H | Ph 4-EtNHC ₂ O-3-F-Ph | |
| 3097 | H | H | i-Pr | H | H | Ph 3-I-4-iPrNHCOC(Me) ₂ CH ₂ O-Ph | |
| 3098 | H | H | i-Pr | H | H | Ph 3-Br-4-CH ₂ =CHCH ₂ NHC ₂ O-Ph | |
| 3099 | H | H | i-Pr | H | H | Ph 4-iBuNHC ₂ O-3-F-Ph | |
| 3100 | H | H | i-Pr | H | H | Ph 3-tBuO ₂ CCH=CH-4-nPrNHC ₂ O-Ph | |
| 3101 | H | H | i-Pr | H | H | Ph 3-HO ₂ CCH=CH-4-nPrNHC ₂ O-Ph | |
| 3102 | H | H | i-Pr | H | H | Ph 3-I-4-MeOCH ₂ CH ₂ NHC ₂ O-Ph | |
| 3103 | H | H | i-Pr | H | H | Ph 3-F-4-HO-Ph | |
| 3104 | H | H | i-Pr | H | H | Ph 3-F-4-MeO-Ph | |
| 3105 | H | H | i-Pr | H | H | Ph 3,4-methylenedioxyPh | |
| 3106 | H | H | i-Pr | H | H | Ph 3,4-ethylenedioxyPh | |
| 3107 | H | H | i-Pr | H | H | Ph 3,4-Cl ₂ -Ph | |
| 3108 | H | H | i-Pr | H | H | Ph 3,4-Me ₂ -Ph | |
| 3109 | H | H | i-Pr | H | H | Ph 3,4-F ₂ -Ph | |
| 3110 | H | H | i-Pr | H | H | Ph 3,4-(MeO) ₂ -Ph | |
| 3111 | H | H | i-Pr | H | H | Ph 3,5-(MeO) ₂ -Ph | |
| 3112 | H | H | i-Pr | H | H | Ph 3,5-Me ₂ -Ph | |
| 3113 | H | H | i-Pr | H | H | Ph 3,5-I ₂ -4-HO-Ph | |
| 3114 | H | H | i-Pr | H | H | Ph 2,4-I ₂ -5-HO-Ph | |
| 3115 | H | H | i-Pr | H | H | Ph 3,5-I ₂ -4-MeO-Ph | |
| 3116 | H | H | i-Pr | H | H | Ph 2,4-I ₂ -5-MeO-Ph | |
| 3117 | H | H | i-Pr | H | H | Ph 2,4,6-Me ₃ -Ph | |

| | | | | | | | |
|------|---------------------|---|------|---|---|----|---|
| 3118 | H | H | i-Pr | H | H | Ph | 4-HO(CH ₂) ₃ O-3,5-I ₂ Ph |
| 3119 | H | H | i-Pr | H | H | Ph | 3,5-I ₂ -4-nPrNHCOCH ₂ O-Ph |
| 3120 | H | H | i-Pr | H | H | Ph | 2-thienyl |
| 3121 | H | H | i-Pr | H | H | Ph | 2-furyl |
| 3122 | H | H | i-Pr | H | H | Ph | 3-pyridyl |
| 3123 | H | H | i-Pr | H | H | Ph | 2-naphthyl |
| 3124 | H | H | i-Pr | H | H | Ph | 5-F-1-naphthyl |
| 3125 | H | H | i-Pr | H | H | Ph | dibenzothiophene-2-yl |
| 3126 | 6-F | H | i-Pr | H | H | Ph | Ph |
| 3127 | 7-F | H | i-Pr | H | H | Ph | Ph |
| 3128 | 8-F | H | i-Pr | H | H | Ph | Ph |
| 3129 | 9-F | H | i-Pr | H | H | Ph | Ph |
| 3130 | 6-MeO | H | i-Pr | H | H | Ph | Ph |
| 3131 | 9-MeO | H | i-Pr | H | H | Ph | Ph |
| 3132 | 6-OH | H | i-Pr | H | H | Ph | Ph |
| 3133 | 9-OH | H | i-Pr | H | H | Ph | Ph |
| 3134 | 7-NO ₂ | H | i-Pr | H | H | Ph | Ph |
| 3135 | 8-NO ₂ | H | i-Pr | H | H | Ph | Ph |
| 3136 | 9-NO ₂ | H | i-Pr | H | H | Ph | Ph |
| 3137 | 6-NHPh | H | i-Pr | H | H | Ph | Ph |
| 3138 | 7-Me ₂ N | H | i-Pr | H | H | Ph | Ph |
| 3139 | 7-Me | H | i-Pr | H | H | Ph | Ph |
| 3140 | 8-Me | H | i-Pr | H | H | Ph | Ph |
| 3141 | 7-t-Bu | H | i-Pr | H | H | Ph | Ph |

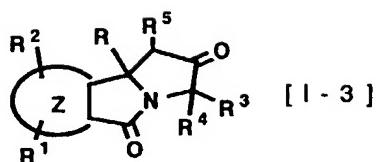
(表25)



| 化合物例 | R ¹ | R ² | R ³ | R ⁴ | R ⁶ | Z | R |
|------|----------------|----------------|----------------|----------------|----------------|--------------|----|
| 3142 | 8-t-Bu | H | i-Pr | H | H | Ph | Ph |
| 3143 | 7-Br | H | i-Pr | H | H | Ph | Ph |
| 3144 | 8-Br | H | i-Pr | H | H | Ph | Ph |
| 3145 | 7-Cl | H | i-Pr | H | H | Ph | Ph |
| 3146 | 8-Cl | H | i-Pr | H | H | Ph | Ph |
| 3147 | 7-Cl | 8-Cl | i-Pr | H | H | Ph | Ph |
| 3148 | 6-Cl | 9-Cl | i-Pr | H | H | Ph | Ph |
| 3149 | 6-OH | 9-I | i-Pr | H | H | Ph | Ph |
| 3150 | H | H | i-Pr | H | H | 1,2-naphthyl | Ph |
| 3151 | H | H | i-Pr | H | H | 2,3-naphthyl | Ph |
| 3152 | H | H | i-Pr | H | H | cyclohexenyl | Ph |
| 3153 | H | H | D-Leucine | H | H | Ph | Ph |
| 3154 | H | H | L-Leucine | H | H | Ph | Ph |
| 3155 | H | H | D-NorLeucine | H | H | Ph | Ph |
| 3156 | H | H | L-NorLeucine | H | H | Ph | Ph |
| 3157 | H | H | D-AlloLeucine | H | H | Ph | Ph |
| 3158 | H | H | L-AlloLeucine | H | H | Ph | Ph |
| 3159 | H | H | D-NorValine | H | H | Ph | Ph |
| 3160 | H | H | L-NorValine | H | H | Ph | Ph |
| 3161 | H | H | D-Alanine | H | H | Ph | Ph |
| 3162 | H | H | L-Alanine | H | H | Ph | Ph |
| 3163 | H | H | D-Arginine | H | H | Ph | Ph |
| 3164 | H | H | L-Arginine | H | H | Ph | Ph |

| | | | | | | | |
|------|---|---|-----------------|---|---|----|---------|
| 3165 | H | H | D-Asparagine | H | H | Ph | Ph |
| 3166 | H | H | L-Asparagine | H | H | Ph | Ph |
| 3167 | H | H | D-Glutamic Acid | H | H | Ph | Ph |
| 3168 | H | H | L-Glutamic Acid | H | H | Ph | Ph |
| 3169 | H | H | D-Glutamine | H | H | Ph | Ph |
| 3170 | H | H | L-Glutamine | H | H | Ph | Ph |
| 3171 | H | H | D-Histidine | H | H | Ph | Ph |
| 3172 | H | H | L-Histidine | H | H | Ph | Ph |
| 3173 | H | H | D-Methionine | H | H | Ph | Ph |
| 3174 | H | H | L-Methionine | H | H | Ph | Ph |
| 3175 | H | H | D-Tryptophan | H | H | Ph | Ph |
| 3176 | H | H | L-Tryptophan | H | H | Ph | Ph |
| 3177 | H | H | D-Tyrosine | H | H | Ph | Ph |
| 3178 | H | H | L-Tyrosine | H | H | Ph | Ph |
| 3179 | H | H | Homo Phenylalar | H | H | Ph | Ph |
| 3180 | H | H | Homo Phenylalar | H | H | Ph | Ph |
| 3181 | H | H | D-Leucine | H | H | Ph | 4-Cl-Ph |
| 3182 | H | H | L-Leucine | H | H | Ph | 4-Cl-Ph |
| 3183 | H | H | D- NorLeucine | H | H | Ph | 4-Cl-Ph |
| 3184 | H | H | L- NorLeucine | H | H | Ph | 4-Cl-Ph |
| 3185 | H | H | D- AlloLeucine | H | H | Ph | 4-Cl-Ph |
| 3186 | H | H | L- AlloLeucine | H | H | Ph | 4-Cl-Ph |
| 3187 | H | H | D- NorValine | H | H | Ph | 4-Cl-Ph |

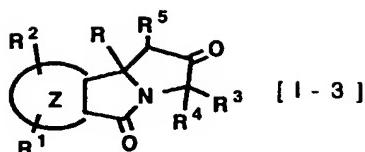
(表26)



| 化合物例 | R ¹ | R ² | R ³ | R ⁴ | R ⁶ | Z | R |
|------|----------------|----------------|---------------------------------------|----------------|----------------|----|---------|
| 3188 | H | H | L-NorValine | H | H | Ph | 4-Cl-Ph |
| 3189 | H | H | D-Alanine | H | H | Ph | 4-Cl-Ph |
| 3190 | H | H | L-Alanine | H | H | Ph | 4-Cl-Ph |
| 3191 | H | H | D-Arginine | H | H | Ph | 4-Cl-Ph |
| 3192 | H | H | L-Arginine | H | H | Ph | 4-Cl-Ph |
| 3193 | H | H | D-Asparagine | H | H | Ph | 4-Cl-Ph |
| 3194 | H | H | L-Asparagine | H | H | Ph | 4-Cl-Ph |
| 3195 | H | H | D-Glutamic Acid | H | H | Ph | 4-Cl-Ph |
| 3196 | H | H | L-Glutamic Acid | H | H | Ph | 4-Cl-Ph |
| 3197 | H | H | D-Glutamine | H | H | Ph | 4-Cl-Ph |
| 3198 | H | H | L-Glutamine | H | H | Ph | 4-Cl-Ph |
| 3199 | H | H | D-Histidine | H | H | Ph | 4-Cl-Ph |
| 3200 | H | H | L-Histidine | H | H | Ph | 4-Cl-Ph |
| 3201 | H | H | D-Methionine | H | H | Ph | 4-Cl-Ph |
| 3202 | H | H | L-Methionine | H | H | Ph | 4-Cl-Ph |
| 3203 | H | H | D-Tryptophan | H | H | Ph | 4-Cl-Ph |
| 3204 | H | H | L-Tryptophan | H | H | Ph | 4-Cl-Ph |
| 3205 | H | H | D-Tyrosine | H | H | Ph | 4-Cl-Ph |
| 3206 | H | H | L-Tyrosine | H | H | Ph | 4-Cl-Ph |
| 3207 | H | H | D- Homo Phenylalanine | H | H | Ph | 4-Cl-Ph |
| 3208 | H | H | L- Homo Phenylalanine | H | H | Ph | 4-Cl-Ph |
| 3209 | H | H | t-Bu | H | H | Ph | Ph |
| 3210 | H | H | (CH ₃) ₂ (OH)C | H | H | Ph | Ph |

| | | | |
|------|-----|--|---|
| 3211 | H H | CH ₃ (MeO)CH | H H Ph Ph |
| 3212 | H H | 4-HO-Ph | H H Ph Ph |
| 3213 | H H | 4-HO-3-I-Ph | H H Ph Ph |
| 3214 | H H | 4-HO-3,5-I ₂ -Ph | H H Ph Ph |
| 3215 | H H | 4-HO-3-I-PhCH ₂ | H H Ph Ph |
| 3216 | H H | 4-HO-3,5-I ₂ -PhCH ₂ | H H Ph Ph |
| 3217 | H H | 1-naphthylmethyl | H H Ph Ph |
| 3218 | H H | 4-F-PhCH ₂ | H H Ph Ph |
| 3219 | H H | 1-naphthylmethyl | H H Ph 4-Cl-Ph |
| 3220 | H H | 4-F-PhCH ₂ | H H Ph 4-Cl-Ph |
| 3221 | H H | i-Pr | Me H Ph 4-Cl-Ph |
| 3222 | H H | Me | Me H Ph Ph |
| 3223 | H H | (R ⁴ と一緒にになって)CH ₂ = | - H Ph Ph |
| 3224 | H H | (R ⁴ と一緒にになって)MeCH= | - H Ph Ph |
| 3225 | H H | (R ⁴ と一緒にになって)(CH ₂) ₄ | - H Ph Ph |
| 3226 | H H | i-Pr | H H Ph 4-n-PrNHCOCH ₂ CH ₂ O-Ph |
| 3227 | H H | i-Pr | H H Ph 4-i-PrNHCOCH ₂ CH ₂ O-Ph |
| 3228 | H H | i-Pr | H H Ph 4-EtNHCOCH ₂ CH ₂ O-Ph |
| 3229 | H H | i-Pr | H H Ph 4-EtCH(Me)NHCOCH ₂ CH ₂ O-Ph |
| 3230 | H H | i-Pr | H H Ph 3-Cl-4-i-PrNHCOCH ₂ O-Ph |
| 3231 | H H | i-Pr | H H Ph 3-Cl-4-EtNHCOCH ₂ O-Ph |
| 3232 | H H | i-Pr | H H Ph 3-Cl-4-EtCH(Me)NHCOCH ₂ O-Ph |
| 3233 | H H | i-Pr | H H Ph 4-i-PrNHCOCH ₂ O-3-Me-Ph |

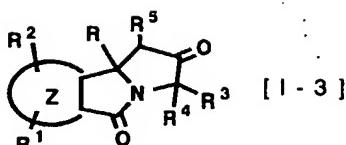
(表27)



| 化合物例 | R ¹ | R ² | R ³ | R ⁴ | R ⁵ | Z | R |
|------|----------------|----------------|----------------|----------------|----------------|----|--|
| 3234 | H | H | i-Pr | H | H | Ph | 4-EtNHCOCH ₂ O-3-Me-Ph |
| 3235 | H | H | i-Pr | H | H | Ph | 4-EtCH(Me)NHCOCH ₂ O-3-Me-Ph |
| 3236 | H | H | i-Pr | H | H | Ph | 4-cycloPrNHCOCH ₂ CH ₂ O-Ph |
| 3237 | H | H | i-Pr | H | H | Ph | 4-cycloPentyNHCOCH ₂ CH ₂ O-Ph |
| 3238 | H | H | i-Pr | H | H | Ph | 3-I-4-n-PrNHCOCH ₂ CH ₂ O-Ph |
| 3239 | H | H | i-Pr | H | H | Ph | 3-I-4-i-PrNHCOCH ₂ CH ₂ O-Ph |
| 3240 | H | H | i-Pr | H | H | Ph | 4-EtNHCOCH ₂ CH ₂ O-3-I-Ph |
| 3241 | H | H | i-Pr | H | H | Ph | 4-EtCH(Me)NHCOCH ₂ CH ₂ O-3-I-Ph |
| 3242 | H | H | i-Pr | H | H | Ph | 4-EtCOCH ₂ CH ₂ O-3-I-Ph |
| 3243 | H | H | i-Pr | H | H | Ph | 4-cycloPrNHCOCH ₂ CH ₂ O-3-I-Ph |
| 3244 | H | H | i-Pr | H | H | Ph | 4-cycloPentyNHCOCH ₂ CH ₂ O-3-I-Ph |
| 3245 | H | H | i-Pr | H | H | Ph | 3-F-4-n-PrNHCOCH ₂ CH ₂ O-Ph |
| 3246 | H | H | i-Pr | H | H | Ph | 3-F-4-i-PrNHCOCH ₂ CH ₂ O-Ph |
| 3247 | H | H | i-Pr | H | H | Ph | 4-EtNHCOCH ₂ CH ₂ O-3-F-Ph |
| 3248 | H | H | i-Pr | H | H | Ph | 4-EtCH(Me)NHCOCH ₂ CH ₂ O-3-F-Ph |
| 3249 | H | H | i-Pr | H | H | Ph | 4-EtCOCH ₂ CH ₂ O-3-F-Ph |
| 3250 | H | H | i-Pr | H | H | Ph | 3-F-4-i-BuNHCOCH ₂ CH ₂ O-Ph |
| 3251 | H | H | i-Pr | H | H | Ph | 4-cycloPrNHCOCH ₂ CH ₂ O-3-F-Ph |
| 3252 | H | H | i-Pr | H | H | Ph | 3-Br-4-n-PrNHCOCH ₂ CH ₂ O-Ph |
| 3253 | H | H | i-Pr | H | H | Ph | 3-Br-4-i-PrNHCOCH ₂ CH ₂ O-Ph |
| 3254 | H | H | i-Pr | H | H | Ph | 3-Br-4-EtNHCOCH ₂ CH ₂ O-Ph |
| 3255 | H | H | i-Pr | H | H | Ph | 3-Br-4-i-BuNHCOCH ₂ CH ₂ O-Ph |
| 3256 | H | H | i-Pr | H | H | Ph | 3-Cl-4-n-PrNHCOCH ₂ CH ₂ O-Ph |

| | | | | | | | |
|------|---|---|------|---|---|----|---|
| 3257 | H | H | i-Pr | H | H | Ph | 3-Cl-4-i-PrNHC ₂ CH ₂ O-Ph |
| 3258 | H | H | i-Pr | H | H | Ph | 3-Cl-4-EtNHC ₂ CH ₂ O-Ph |
| 3259 | H | H | i-Pr | H | H | Ph | 3-Cl-4-EtCH(Me)NHC ₂ CH ₂ O-Ph |
| 3260 | H | H | i-Pr | H | H | Ph | 3-Cl-4-cycloPrNHC ₂ CH ₂ O-Ph |
| 3261 | H | H | i-Pr | H | H | Ph | 3-Cl-4-cycloPentyNHCOCH ₂ CH ₂ O-Ph |
| 3262 | H | H | i-Pr | H | H | Ph | 3-Me-4-n-PrNHC ₂ CH ₂ O-Ph |
| 3263 | H | H | i-Pr | H | H | Ph | 4-i-PrNHC ₂ CH ₂ O-3-Me-Ph |
| 3264 | H | H | i-Pr | H | H | Ph | 4-EtNHC ₂ CH ₂ O-3-Me-Ph |
| 3265 | H | H | i-Pr | H | H | Ph | 3-Me-4-MeNHC ₂ CH ₂ O-Ph |
| 3266 | H | H | i-Pr | H | H | Ph | 3-Me-4-n-BuNHC ₂ CH ₂ O-Ph |
| 3267 | H | H | i-Pr | H | H | Ph | 4-EtCH(Me)NHC ₂ CH ₂ O-3-Me-Ph |
| 3268 | H | H | i-Pr | H | H | Ph | 4-EtCOCH ₂ CH ₂ O-3-Me-Ph |
| 3269 | H | H | i-Pr | H | H | Ph | 4-i-BuNHC ₂ CH ₂ O-3-Me-Ph |
| 3270 | H | H | i-Pr | H | H | Ph | 3-Me-4-t-BuNHC ₂ CH ₂ O-Ph |
| 3271 | H | H | i-Pr | H | H | Ph | 4-cycloPrNHC ₂ CH ₂ O-3-Me-Ph |
| 3272 | H | H | i-Pr | H | H | Ph | 4-cycloPentyNHCOCH ₂ CH ₂ O-3-Me-Ph |
| 3273 | H | H | Me | H | H | Ph | 3-Cl-4-n-PrNHC ₂ O-Ph |
| 3274 | H | H | Me | H | H | Ph | 3-Cl-4-i-PrNHC ₂ O-Ph |
| 3275 | H | H | Me | H | H | Ph | 3-Cl-4-EtNHC ₂ O-Ph |
| 3276 | H | H | Me | H | H | Ph | 3-Cl-4-EtCH(Me)NHC ₂ O-Ph |
| 3277 | H | H | Me | H | H | Ph | 3-Cl-4-cycloPrNHC ₂ O-Ph |
| 3278 | H | H | Me | H | H | Ph | 3-Cl-4-cycloPentyNHCOCH ₂ O-Ph |
| 3279 | H | H | Et | H | H | Ph | 3-Me-4-n-PrNHC ₂ O-Ph |

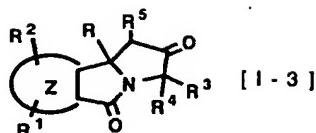
(表28)



| 化合物例 | R ¹ | R ² | R ³ | R ⁴ | R ⁵ | Z | R |
|------|----------------|----------------|----------------|----------------|----------------|----|---|
| 3280 | H | H | Et | H | H | Ph | 4-i-PrNHCOCH ₂ O-3-Me-Ph |
| 3281 | H | H | Et | H | H | Ph | 4-EtNHCOCH ₂ O-3-Me-Ph |
| 3282 | H | H | Et | H | H | Ph | 3-Me-4-MeNHCOCH ₂ O-Ph |
| 3283 | H | H | Et | H | H | Ph | 3-Me-4-n-BuNHCOCH ₂ O-Ph |
| 3284 | H | H | Et | H | H | Ph | 4-EtCH(Me)NHCOCH ₂ O-3-Me-Ph |
| 3285 | H | H | Et | H | H | Ph | 4-EtCOCH ₂ O-3-Me-Ph |
| 3286 | H | H | Et | H | H | Ph | 4-i-BuNHCOCH ₂ O-3-Me-Ph |
| 3287 | H | H | Pr | H | H | Ph | 3-Cl-4-n-PrNHCOCH ₂ O-Ph |
| 3288 | H | H | Pr | H | H | Ph | 3-Cl-4-i-PrNHCOCH ₂ O-Ph |
| 3289 | H | H | Pr | H | H | Ph | 3-Cl-4-EtNHCOCH ₂ O-Ph |
| 3290 | H | H | Pr | H | H | Ph | 3-Cl-4-EtCH(Me)NHCOCH ₂ O-Ph |
| 3291 | H | H | Pr | H | H | Ph | 3-Cl-4-cycloPrNHCOCH ₂ O-Ph |
| 3292 | H | H | Pr | H | H | Ph | 3-Cl-4-cycloPentyNHCOCH ₂ O-Ph |
| 3293 | H | H | Bu | H | H | Ph | 3-Me-4-n-PrNHCOCH ₂ O-Ph |
| 3294 | H | H | Bu | H | H | Ph | 4-i-PrNHCOCH ₂ O-3-Me-Ph |
| 3295 | H | H | Bu | H | H | Ph | 4-EtNHCOCH ₂ O-3-Me-Ph |
| 3296 | H | H | Bu | H | H | Ph | 3-Me-4-MeNHCOCH ₂ O-Ph |
| 3297 | H | H | Bu | H | H | Ph | 3-Me-4-n-BuNHCOCH ₂ O-Ph |
| 3298 | H | H | Bu | H | H | Ph | 4-EtCH(Me)NHCOCH ₂ O-3-Me-Ph |
| 3299 | H | H | Bu | H | H | Ph | 4-EtCOCH ₂ O-3-Me-Ph |
| 3300 | H | H | Bu | H | H | Ph | 4-i-BuNHCOCH ₂ O-3-Me-Ph |
| 3301 | H | H | i-Bu | H | H | Ph | 3-Cl-4-n-PrNHCOCH ₂ O-Ph |
| 3302 | H | H | i-Bu | H | H | Ph | 3-Cl-4-i-PrNHCOCH ₂ O-Ph |

| | | | | | | | |
|------|---|---|-------------------|----|---|-------------|---|
| 3303 | H | H | i-Bu | H | H | Ph | 3-Cl-4-EtNHCOCH ₂ O-Ph |
| 3304 | H | H | i-Bu | H | H | Ph | 3-Cl-4-EtCH(Me)NHCOCH ₂ O-Ph |
| 3305 | H | H | i-Bu | H | H | Ph | 3-Cl-4-cycloPrNHCOCH ₂ O-Ph |
| 3306 | H | H | i-Bu | H | H | Ph | 3-Cl-4-cycloPentyNHCOCH ₂ O-Ph |
| 3307 | H | H | t-Bu | H | H | Ph | 3-Me-4-n-PrNHCOCH ₂ O-Ph |
| 3308 | H | H | t-Bu | H | H | Ph | 4-i-PrNHCOCH ₂ O-3-Me-Ph |
| 3309 | H | H | t-Bu | H | H | Ph | 4-EtNHCOCH ₂ O-3-Me-Ph |
| 3310 | H | H | t-Bu | H | H | Ph | 3-Me-4-MeNHCOCH ₂ O-Ph |
| 3311 | H | H | PhCH ₂ | H | H | Ph | 3-Me-4-n-BuNHCOCH ₂ O-Ph |
| 3312 | H | H | PhCH ₂ | H | H | Ph | 4-EtCH(Me)NHCOCH ₂ O-3-Me-Ph |
| 3313 | H | H | PhCH ₂ | H | H | Ph | 4-EtCOCH ₂ O-3-Me-Ph |
| 3314 | H | H | PhCH ₂ | H | H | Ph | 4-i-BuNHCOCH ₂ O-3-Me-Ph |
| 3315 | H | H | i-Pr | Me | H | Ph | 3-Cl-4-n-PrNHCOCH ₂ O-Ph |
| 3316 | H | H | i-Pr | Me | H | Ph | 3-Cl-4-i-PrNHCOCH ₂ O-Ph |
| 3317 | H | H | i-Pr | Me | H | Ph | 3-Cl-4-EtNHCOCH ₂ O-Ph |
| 3318 | H | H | i-Pr | Me | H | Ph | 3-Cl-4-EtCH(Me)NHCOCH ₂ O-Ph |
| 3319 | H | H | i-Pr | Me | H | Ph | 3-Cl-4-cycloPrNHCOCH ₂ O-Ph |
| 3320 | H | H | i-Pr | Me | H | Ph | 3-Cl-4-cycloPentyNHCOCH ₂ O-Ph |
| 3321 | H | H | i-Pr | H | H | 2,3-Pyridyl | 3-Me-4-n-PrNHCOCH ₂ O-Ph |
| 3322 | H | H | i-Pr | H | H | 2,3-Pyridyl | 4-i-PrNHCOCH ₂ O-3-Me-Ph |
| 3323 | H | H | i-Pr | H | H | 2,3-Pyridyl | 4-EtNHCOCH ₂ O-3-Me-Ph |
| 3324 | H | H | i-Pr | H | H | 2,3-Pyridyl | 3-Me-4-MeNHCOCH ₂ O-Ph |
| 3325 | H | H | i-Pr | H | H | 2,3-Pyridyl | 3-Me-4-n-BuNHCOCH ₂ O-Ph |

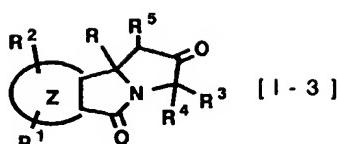
(表29)



| | R ¹ | R ² | R ³ | R ⁴ | R ⁵ | Z | R |
|------|----------------|----------------|----------------|----------------|----------------|-------------|---|
| 3326 | H | H | i-Pr | H | H | 2,3-Pyridyl | 4-EtCH(Me)NHCOCH ₂ O-3-Me-Ph |
| 3327 | H | H | i-Pr | H | H | 2,3-Pyridyl | 4-EtCOCH ₂ O-3-Me-Ph |
| 3328 | H | H | i-Pr | H | H | 2,3-Pyridyl | 4-i-BuNHCOCH ₂ O-3-Me-Ph |
| 3329 | H | H | i-Pr | H | H | 2,3-Pyridyl | 3-Cl-4-n-PrNHCOCH ₂ O-Ph |
| 3330 | H | H | i-Pr | H | H | 3,4-Pyridyl | 3-Cl-4-i-PrNHCOCH ₂ O-Ph |
| 3331 | H | H | i-Pr | H | H | 3,4-Pyridyl | 3-Cl-4-EtNHCOCH ₂ O-Ph |
| 3332 | H | H | i-Pr | H | H | 3,4-Pyridyl | 3-Cl-4-EtCH(Me)NHCOCH ₂ O-Ph |
| 3333 | H | H | i-Pr | H | H | 3,4-Pyridyl | 3-Cl-4-cycloPrNHCOCH ₂ O-Ph |
| 3334 | H | H | i-Pr | H | H | 3,4-Pyridyl | 3-Cl-4-cycloPentylNHCOCH ₂ O-Ph |
| 3335 | H | H | i-Pr | H | H | Ph | 4-F-5-n-PrNHCOCH ₂ O-(2-pyridyl) |
| 3336 | H | H | i-Pr | H | H | Ph | 4-F-5-i-PrNHCOCH ₂ O-(2-pyridyl) |
| 3337 | H | H | i-Pr | H | H | Ph | 4-EtNHCOCH ₂ O-3-F-(2-pyridyl) |
| 3338 | H | H | i-Pr | H | H | Ph | 4-EtCH(Me)NHCOCH ₂ O-3-F-(2-pyridyl) |
| 3339 | H | H | i-Pr | H | H | Ph | 4-EtCOCH ₂ O-3-F-(2-pyridyl) |
| 3340 | H | H | i-Pr | H | H | Ph | 3-F-4-i-BuNHCOCH ₂ O-(2-pyridyl) |
| 3341 | H | H | i-Pr | H | H | Ph | 4-cycloPrNHCOCH ₂ O-3-F-(2-pyridyl) |
| 3342 | H | H | i-Pr | H | H | Ph | 5-I-6-n-PrNHCOCH ₂ O-(3-pyridyl) |
| 3343 | H | H | i-Pr | H | H | Ph | 5-I-6-i-PrNHCOCH ₂ O-(3-pyridyl) |
| 3344 | H | H | i-Pr | H | H | Ph | 6-EtNHCOCH ₂ O-5-I-(3-pyridyl) |
| 3345 | H | H | i-Pr | H | H | Ph | 6-EtCH(Me)NHCOCH ₂ O-5-I-(3-pyridyl) |
| 3346 | H | H | i-Pr | H | H | Ph | 6-EtCOCH ₂ O-5-I-(3-pyridyl) |
| 3347 | H | H | i-Pr | H | H | Ph | 6-cycloPrNHCOCH ₂ O-5-I-(3-pyridyl) |
| 3348 | H | H | i-Pr | H | H | Ph | 3-NO ₂ -4-n-PrNHCOCH ₂ O-Ph |

| | | | | | | | |
|------|---|---|------|---|---|----|--|
| 3349 | H | H | i-Pr | H | H | Ph | 3-NO ₂ -4-i-PrNHCOCH ₂ O-Ph |
| 3350 | H | H | i-Pr | H | H | Ph | 4-EtNHCOCH ₂ O-3-NO ₂ -Ph |
| 3351 | H | H | i-Pr | H | H | Ph | 4-EtCH(Me)NHCOCH ₂ O-3-NO ₂ -Ph |
| 3352 | H | H | i-Pr | H | H | Ph | 4-EtCOCH ₂ O-3-NO ₂ -Ph |
| 3353 | H | H | i-Pr | H | H | Ph | 4-i-BuNHCOCH ₂ O-3-NO ₂ -Ph |
| 3354 | H | H | i-Pr | H | H | Ph | 4-cycloPrNHCOCH ₂ O-3-NO ₂ -Ph |
| 3355 | H | H | i-Pr | H | H | Ph | 3-MeO-4-n-PrNHCOCH ₂ O-Ph |
| 3356 | H | H | i-Pr | H | H | Ph | 3-MeO-4-i-PrNHCOCH ₂ O-Ph |
| 3357 | H | H | i-Pr | H | H | Ph | 4-EtNHCOCH ₂ O-3-MeO-Ph |
| 3358 | H | H | i-Pr | H | H | Ph | 4-EtCH(Me)NHCOCH ₂ O-3-MeO-Ph |
| 3359 | H | H | i-Pr | H | H | Ph | 4-EtCOCH ₂ O-3-MeO-Ph |
| 3360 | H | H | i-Pr | H | H | Ph | 3-MeO-4-i-BuNHCOCH ₂ O-Ph |
| 3361 | H | H | i-Pr | H | H | Ph | 4-cycloPrNHCOCH ₂ O-3-MeO-Ph |
| 3362 | H | H | i-Pr | H | H | Ph | 3-HO-4-n-PrNHCOCH ₂ O-Ph |
| 3363 | H | H | i-Pr | H | H | Ph | 3-HO-4-i-PrNHCOCH ₂ O-Ph |
| 3364 | H | H | i-Pr | H | H | Ph | 4-EtNHCOCH ₂ O-3-HO-Ph |
| 3365 | H | H | i-Pr | H | H | Ph | 4-EtCH(Me)NHCOCH ₂ O-3-HO-Ph |
| 3366 | H | H | i-Pr | H | H | Ph | 4-EtCOCH ₂ O-3-HO-Ph |
| 3367 | H | H | i-Pr | H | H | Ph | 3-HO-4-i-BuNHCOCH ₂ O-Ph |
| 3368 | H | H | i-Pr | H | H | Ph | 4-cycloPrNHCOCH ₂ O-3-HO-Ph |
| 3369 | H | H | i-Pr | H | H | Ph | 3-H ₂ NCH ₂ CH ₂ NHCOCH ₂ O-Ph |
| 3370 | H | H | i-Pr | H | H | Ph | 2-H ₂ NCH ₂ CH ₂ NHCOCH ₂ O-Ph |
| 3371 | H | H | i-Pr | H | H | Ph | 4-MeNHCH ₂ CH ₂ NHCOCH ₂ O-Ph |

(表30)

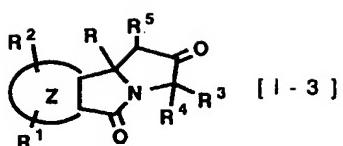


| 化合物例 | R ¹ | R ² | R ³ | R ⁴ | R ⁶ | Z | R |
|------|----------------|----------------|----------------|----------------|----------------|----|---|
| 3372 | H | H | i-Pr | H | H | Ph | 3-MeNHCH ₂ CH ₂ NHCOCH ₂ O-Ph |
| 3373 | H | H | i-Pr | H | H | Ph | 2-MeNHCH ₂ CH ₂ NHCOCH ₂ O-Ph |
| 3374 | H | H | i-Pr | H | H | Ph | 4-Me ₂ NCH ₂ CH ₂ NHCOCH ₂ O-Ph |
| 3375 | H | H | i-Pr | H | H | Ph | 3-Me ₂ NCH ₂ CH ₂ NHCOCH ₂ O-Ph |
| 3376 | H | H | i-Pr | H | H | Ph | 2-Me ₂ NCH ₂ CH ₂ NHCOCH ₂ O-Ph |
| 3377 | H | H | i-Pr | H | H | Ph | 4-H ₂ NCH ₂ CH ₂ NHCOCH ₂ O-3-Cl-Ph |
| 3378 | H | H | i-Pr | H | H | Ph | 3-H ₂ NCH ₂ CH ₂ NHCOCH ₂ O-4-Cl-Ph |
| 3379 | H | H | i-Pr | H | H | Ph | 2-H ₂ NCH ₂ CH ₂ NHCOCH ₂ O-4-Cl-Ph |
| 3380 | H | H | i-Pr | H | H | Ph | 4-MeNHCH ₂ CH ₂ NHCOCH ₂ O-3-Me-Ph |
| 3381 | H | H | i-Pr | H | H | Ph | 3-MeNHCH ₂ CH ₂ NHCOCH ₂ O-4-Me-Ph |
| 3382 | H | H | i-Pr | H | H | Ph | 2-MeNHCH ₂ CH ₂ NHCOCH ₂ O-4-MePh |
| 3383 | H | H | i-Pr | H | H | Ph | 4-Me ₂ NCH ₂ CH ₂ NHCOCH ₂ O-3-F-Ph |
| 3384 | H | H | i-Pr | H | H | Ph | 3-Me ₂ NCH ₂ CH ₂ NHCOCH ₂ O-4-F-Ph |
| 3385 | H | H | i-Pr | H | H | Ph | 2-Me ₂ NCH ₂ CH ₂ NHCOCH ₂ O-4-F-Ph |
| 3386 | H | H | i-Pr | H | H | Ph | 4-H ₂ NCOCH ₂ -3-I-Ph |
| 3387 | H | H | i-Pr | H | H | Ph | 3-I-4-MeNHCOCH ₂ -Ph |
| 3388 | H | H | i-Pr | H | H | Ph | 4-EtNHCOCH ₂ -3-I-Ph |
| 3389 | H | H | i-Pr | H | H | Ph | 3-I-4-nPrNHCOCH ₂ -Ph |
| 3390 | H | H | i-Pr | H | H | Ph | 3-I-4-iPrNHCOCH ₂ -Ph |
| 3391 | H | H | i-Pr | H | H | Ph | 4-nBuNHCOCH ₂ -3-I-Ph |
| 3392 | H | H | i-Pr | H | H | Ph | 4-tBuNHCOCH ₂ -3-I-Ph |
| 3393 | H | H | i-Pr | H | H | Ph | 4-iBuNHCOCH ₂ -Ph |
| 3394 | H | H | i-Pr | H | H | Ph | 4-tBuO ₂ CCH ₂ -3-I-Ph |
| 3395 | H | H | i-Pr | H | H | Ph | 3-I-4-PhCH ₂ NHCOCH ₂ -Ph |

100 / 1

| | | | | | | | |
|------|---|---|------|---|----|----|--|
| 3396 | H | H | i-Pr | H | H | Ph | 3-I-4-(2-tetrahydrofuryl)CH ₂ NHCOCH ₂ -Ph |
| 3397 | H | H | i-Pr | H | H | Ph | 4-cycloPrNHCOCH ₂ -3-I-Ph |
| 3398 | H | H | i-Pr | H | H | Ph | 4-cycloPentyNHCOCH ₂ -3-I-Ph |
| 3399 | H | H | i-Pr | H | H | Ph | 4-cycloHexylNHCOCH ₂ -3-I-Ph |
| 3400 | H | H | i-Pr | H | H | Ph | 4-cycloPrNHCOCH ₂ -3-F-Ph |
| 3401 | H | H | i-Pr | H | H | Ph | 3-Cl-4-i-PrNHCOCH ₂ CH ₂ -Ph |
| 3402 | H | H | i-Pr | H | H | Ph | 3-Cl-4-EtNHCOCH ₂ CH ₂ -Ph |
| 3403 | H | H | i-Pr | H | H | Ph | 3-Cl-4-EtCH(Me)NHCOCH ₂ CH ₂ -Ph |
| 3404 | H | H | i-Pr | H | H | Ph | 4-i-PrNHCO-3-Me-Ph |
| 3405 | H | H | i-Pr | H | H | Ph | 4-EtNHCO-3-Me-Ph |
| 3406 | H | H | i-Pr | H | H | Ph | 4-EtCH(Me)NHCO-3-Me-Ph |
| 3407 | H | H | i-Pr | H | H | Ph | 3-Cl-4-i-PrNHCH ₂ CH ₂ O-Ph |
| 3408 | H | H | i-Pr | H | H | Ph | 3-Cl-4-EtNHCH ₂ CH ₂ O-Ph |
| 3409 | H | H | i-Pr | H | H | Ph | 3-Cl-4-EtCH(Me)NHCH ₂ CH ₂ O-Ph |
| 3410 | H | H | i-Pr | H | Me | Ph | 3-Cl-4-n-PrNHCOCH ₂ O-Ph |
| 3411 | H | H | i-Pr | H | Me | Ph | 3-Cl-4-i-PrNHCOCH ₂ O-Ph |
| 3412 | H | H | i-Pr | H | Me | Ph | 3-Cl-4-EtNHCOCH ₂ O-Ph |
| 3413 | H | H | i-Pr | H | Me | Ph | 3-Cl-4-EtCH(Me)NHCOCH ₂ O-Ph |
| 3414 | H | H | i-Pr | H | Me | Ph | 3-Cl-4-cycloPrNHCOCH ₂ O-Ph |
| 3415 | H | H | i-Pr | H | Me | Ph | 3-Cl-4-cycloPentyNHCOCH ₂ O-Ph |
| 3416 | H | H | i-Pr | H | Et | Ph | 3-Me-4-n-PrNHCOCH ₂ O-Ph |
| 3417 | H | H | i-Pr | H | Et | Ph | 4-i-PrNHCOCH ₂ O-3-Me-Ph |

(表31)



| 化合物例 | R ¹ | R ² | R ³ | R ⁴ | R ⁶ | Z | R |
|------|----------------|----------------|----------------|----------------|----------------|----|--|
| 3418 | H | H | i-Pr | H | Et | Ph | 4-EtNHCOCH ₂ O-3-Me-Ph |
| 3419 | H | H | i-Pr | H | Et | Ph | 3-Me-4-MeNHCOCH ₂ O-Ph |
| 3420 | H | H | i-Pr | H | Et | Ph | 3-Me-4-n-BuNHCOCH ₂ O-Ph |
| 3421 | H | H | i-Pr | H | Et | Ph | 4-EtCH(Me)NHCOCH ₂ O-3-Me-Ph |
| 3422 | H | H | i-Pr | H | Et | Ph | 4-EtCOCH ₂ O-3-Me-Ph |
| 3423 | H | H | i-Pr | H | Et | Ph | 4-i-BuNHCOCH ₂ O-3-Me-Ph |
| 3424 | H | H | i-Pr | H | Ac | Ph | 3-Cl-4-n-PrNHCOCH ₂ O-Ph |
| 3425 | H | H | i-Pr | H | Ac | Ph | 3-Cl-4-i-PrNHCOCH ₂ O-Ph |
| 3426 | H | H | i-Pr | H | Ac | Ph | 3-Cl-4-EtNHCOCH ₂ O-Ph |
| 3427 | H | H | i-Pr | H | Ac | Ph | 3-Cl-4-EtCH(Me)NHCOCH ₂ O-Ph |
| 3428 | H | H | i-Pr | H | Ac | Ph | 3-Cl-4-cycloPrNHCOCH ₂ O-Ph |
| 3429 | H | H | i-Pr | H | Ac | Ph | 3-Cl-4-cycloPentylNHCOCH ₂ O-Ph |
| 3430 | H | H | i-Pr | H | OH | Ph | 3-Me-4-n-PrNHCOCH ₂ O-Ph |
| 3431 | H | H | i-Pr | H | OH | Ph | 4-i-PrNHCOCH ₂ O-3-Me-Ph |
| 3432 | H | H | i-Pr | H | OH | Ph | 4-EtNHCOCH ₂ O-3-Me-Ph |
| 3433 | H | H | i-Pr | H | OH | Ph | 3-Me-4-MeNHCOCH ₂ O-Ph |
| 3434 | H | H | i-Pr | H | OH | Ph | 3-Me-4-n-BuNHCOCH ₂ O-Ph |
| 3435 | H | H | i-Pr | H | OH | Ph | 4-EtCH(Me)NHCOCH ₂ O-3-Me-Ph |
| 3436 | H | H | i-Pr | H | OH | Ph | 4-EtCOCH ₂ O-3-Me-Ph |
| 3437 | H | H | i-Pr | H | OH | Ph | 4-i-BuNHCOCH ₂ O-3-Me-Ph |
| 3438 | H | H | i-Pr | H | OMe | Ph | 3-Cl-4-n-PrNHCOCH ₂ O-Ph |
| 3439 | H | H | i-Pr | H | OMe | Ph | 3-Cl-4-i-PrNHCOCH ₂ O-Ph |
| 3440 | H | H | i-Pr | H | OMe | Ph | 3-Cl-4-EtNHCOCH ₂ O-Ph |

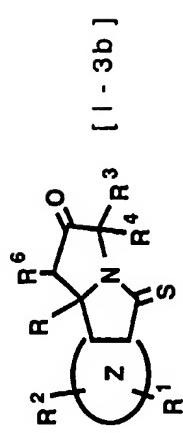
| | | | | | | | |
|------|---|---|------|---|------|----|---|
| 3441 | H | H | i-Pr | H | OMe | Ph | 3-Cl-4-EtCH(Me)NHCOCH ₂ O-Ph |
| 3442 | H | H | i-Pr | H | OMe | Ph | 3-Cl-4-cycloPrNHCOCH ₂ O-Ph |
| 3443 | H | H | i-Pr | H | OMe | Ph | 3-Cl-4-cycloPentyNHCOCH ₂ O-Ph |
| 3444 | H | H | i-Pr | H | OEt | Ph | 3-Me-4-n-PrNHCOCH ₂ O-Ph |
| 3445 | H | H | i-Pr | H | OEt | Ph | 4-i-PrNHCOCH ₂ O-3-Me-Ph |
| 3446 | H | H | i-Pr | H | OEt | Ph | 4-EtNHCOCH ₂ O-3-Me-Ph |
| 3447 | H | H | i-Pr | H | OEt | Ph | 3-Me-4-MeNHCOCH ₂ O-Ph |
| 3448 | H | H | i-Pr | H | OEt | Ph | 3-Me-4-n-BuNHCOCH ₂ O-Ph |
| 3449 | H | H | i-Pr | H | OEt | Ph | 4-EtCH(Me)NHCOCH ₂ O-3-Me-Ph |
| 3450 | H | H | i-Pr | H | OEt | Ph | 4-EtCOCH ₂ O-3-Me-Ph |
| 3451 | H | H | i-Pr | H | OEt | Ph | 4-i-BuNHCOCH ₂ O-3-Me-Ph |
| 3452 | H | H | i-Pr | H | Pr | Ph | 3-Cl-4-n-PrNHCOCH ₂ O-Ph |
| 3453 | H | H | i-Pr | H | Pr | Ph | 3-Cl-4-i-PrNHCOCH ₂ O-Ph |
| 3454 | H | H | i-Pr | H | Pr | Ph | 3-Cl-4-EtNHCOCH ₂ O-Ph |
| 3455 | H | H | i-Pr | H | Pr | Ph | 3-Cl-4-EtCH(Me)NHCOCH ₂ O-Ph |
| 3456 | H | H | i-Pr | H | Pr | Ph | 3-Cl-4-cycloPrNHCOCH ₂ O-Ph |
| 3457 | H | H | i-Pr | H | Pr | Ph | 3-Cl-4-cycloPentyNHCOCH ₂ O-Ph |
| 3458 | H | H | i-Pr | H | i-Pr | Ph | 3-Me-4-n-PrNHCOCH ₂ O-Ph |
| 3459 | H | H | i-Pr | H | i-Pr | Ph | 4-i-PrNHCOCH ₂ O-3-Me-Ph |
| 3460 | H | H | i-Pr | H | i-Pr | Ph | 4-EtNHCOCH ₂ O-3-Me-Ph |
| 3461 | H | H | i-Pr | H | i-Pr | Ph | 3-Me-4-MeNHCOCH ₂ O-Ph |
| 3462 | H | H | i-Pr | H | i-Pr | Ph | 3-Me-4-n-BuNHCOCH ₂ O-Ph |
| 3463 | H | H | i-Pr | H | i-Pr | Ph | 4-EtCH(Me)NHCOCH ₂ O-3-Me-Ph |

(表32)

| 化合物例 | R ¹ | R ² | R ³ | R ⁴ | R ⁵ | Z | R | [1-3] | | |
|------|----------------|----------------|---------------------------------------|----------------|----------------|--|-------------------------------|----------------|----------------|----------------|
| | | | | | | | | R ⁶ | R ⁷ | R ⁸ |
| 3464 | H | H | i-Pr | H | H | pyrimidin-4,5-yl | 4-nBuNHCOCH ₂ O-Ph | | | |
| 3465 | H | H | i-Pr | H | H | 5,6-benzimidazolyl | 4-PrNHCOCH ₂ O-Ph | | | |
| 3466 | H | H | i-Pr | H | H | 3-cycloPrO-4-ηPrNHCOCH ₂ O-Ph | Ph | | | |
| 3467 | H | H | i-Pr | H | H | 3-PhSO ₂ NHCH ₂ NHCO-4-ηPrNHCOCH ₂ O-Ph | Ph | | | |
| 3468 | H | H | i-Pr | H | H | 3-MeHSO ₂ -4-ηPrNHCOCH ₂ O-Ph | Ph | | | |
| 3469 | H | H | PhNHCOCH ₂ CH ₂ | H | H | 4-nPrNHCOCH ₂ O-Ph | Ph | | | |
| 3470 | H | H | MeCONHCH ₂ CH ₂ | H | H | 4-nPrNHCOCH ₂ O-Ph | Ph | | | |
| 3471 | H | H | 4-PhNSO ₂ -pyrazin-2,5-yl | H | H | 4-nPrNHCOCH ₂ O-Ph | Ph | | | |
| 3472 | H | H | i-Pr | H | H | 3-Cl-4-HO-Ph | Ph | | | |
| 3473 | | | i-Pr | H | H | 4-HO-3-MePh | Ph | | | |
| 3474 | | | i-Pr | H | H | 4-HO ₂ CCH ₂ O-3-Me-Ph | Ph | | | |
| 3475 | | | i-Pr | H | H | 3,5-Cl ₂ -4-ηPrNHCOCH ₂ O-Ph | Ph | | | |
| 3476 | | | i-Pr | H | H | 3-Me-4-ηPrNHCSCH ₂ O-Ph | Ph | | | |
| 3477 | | | i-Pr | H | H | 3,5-Cl ₂ -4-ηPrNHCSCH ₂ O-Ph | Ph | | | |
| 3478 | | | i-Pr | H | H | 4-nPentyNHCOCH ₂ O-Ph | Ph | | | |
| 3479 | | | i-Pr | H | H | 4-MeO-Ph | Ph | | | |
| 3480 | | | i-Pr | H | H | 4-HO-Ph | Ph | | | |
| 3481 | | | i-Pr | H | H | 4-nPrNHCOCH ₂ O-Ph | Ph | | | |
| 3482 | | | i-Pr | H | H | 4-nPrNHCOCH ₂ O-Ph | Ph | | | |
| 3483 | | | i-Pr | H | H | 4-nPrNHCOCH ₂ O-Ph | Ph | | | |
| 3484 | | | i-Pr | H | H | 4-nPrNHCOCH ₂ O-Ph | Ph | | | |
| 3485 | | | i-Pr | H | H | 4-nPrNHCOCH ₂ O-Ph | Ph | | | |
| 3486 | | | i-Pr | H | H | 4-nPrNHCOCH ₂ O-Ph | Ph | | | |
| 3487 | | | i-Pr | H | H | 4-nPrNHCOCH ₂ O-Ph | Ph | | | |

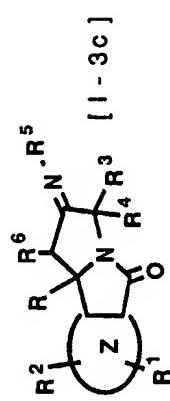
102/1

(表33)



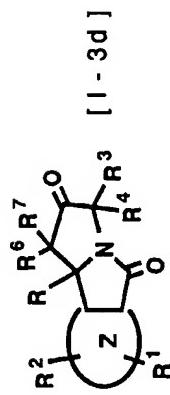
| 化合物例 | R ¹ | R ² | R ³ | R ⁴ | R ⁶ | Z | R |
|------|-------------------|----------------|---|----------------|----------------|--------------------|---|
| 3488 | H | H | i-Pr | H | H | Ph | 3,5-Cl ₂ -4-nPrNHCOC ₂ O-Ph |
| 3489 | H | H | i-Pr | H | H | Ph | 3,5-Cl ₂ -4-nPrNHCSC ₂ O-Ph |
| 3490 | H | H | i-Pr | H | H | Ph | 3-Me-4-nPrNHCOC ₂ O-Ph |
| 3491 | H | H | i-Pr | H | H | Ph | 3-Cl-4-nPrNHCOC ₂ O-Ph |
| 3492 | H | H | i-Pr | H | H | pyrimidin-4,5-yl | 4-nBuNHCOCH ₂ O-Ph |
| 3493 | H | H | i-Pr | H | H | 5,6-benzimidazolyl | 4-PnNHCOCH ₂ O-Ph |
| 3494 | H | H | i-Pr | H | H | Ph | 3-MeSO-4-nPrNHCOC ₂ O-Ph |
| 3495 | Et ₂ N | H | i-Pr | H | H | Ph | 4-nPrNHCOC ₂ O-Ph |
| 3496 | Ph | H | i-Pr | H | H | Ph | 4-nPrNHCOC ₂ O-Ph |
| 3497 | H | H | MeSO ₂ CH ₂ CH ₂ | H | H | Ph | 4-nPrNHCOC ₂ O-Ph |
| 3498 | H | H | PhNSO ₃ CH ₂ -Ph | H | H | Ph | 4-nPrNHCOC ₂ O-Ph |

(表34)



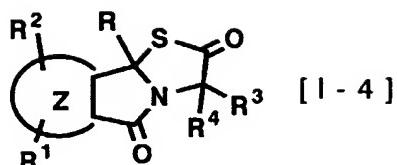
| 化合物例 | R ¹ | R ² | R ³ | R ⁴ | R ⁵ | Z | R | R ⁶ |
|------|----------------|----------------|---|----------------|-----------------------------------|----|---|----------------|
| 3499 | H | H | i-Pr | H | MeO | Ph | 3-Me-4-nPrNHCOCH ₂ O-P | H |
| 3500 | H | H | i-Pr | H | HO | Ph | 3-Cl-4-nPrNHCOCH ₂ O-Pr | H |
| 3501 | H | H | i-Pr | H | Me | Ph | 4-nPrNHCOCH ₂ O-Ph | H |
| 3502 | H | H | i-Pr | H | MeO | Ph | 4-MeOCOCH ₂ NHCOCH ₂ O- | H |
| 3503 | H | H | i-Pr | H | MeO | Ph | 4-PhCONHCH ₂ NHCOCH ₂ C | Me |
| 3504 | H | H | i-Pr | H | MeO | Ph | 4-PhCOCH ₂ NHCOCH ₂ O-P | H |
| 3505 | H | H | i-Pr | H | HOCH ₂ CH ₂ | Ph | 4-nPrNHCOCH ₂ O-Ph | H |
| 3506 | H | H | i-Pr | H | MeO ₂ CCH ₂ | Ph | 4-nPrNHCOCH ₂ O-Ph | H |
| 3507 | H | H | 2-Pyridyl-PhCH ₂ | H | H | Ph | 4-nPrNHCOCH ₂ O-Ph | H |
| 3508 | H | H | MeNHCOCH ₂ O-PhCH ₂ | H | H | Ph | 4-nPrNHCOCH ₂ O-Ph | H |

(表35)



| 化合物例 | R ¹ | R ² | R ³ | R ⁴ | R ⁶ | Z | R | R ⁷ |
|------|----------------|----------------|------------------------------------|----------------|-----------------------------------|----|------------------------------|----------------|
| 3509 | H | H | i-Pr | H | Me | Ph | 4-MeO-Ph | Me |
| 3510 | H | H | i-Pr | H | Me | Ph | 4-HO-Ph | Me |
| 3511 | H | H | i-Pr | H | Me | Ph | 4-nPrNHCOC ₂ O-Ph | Me |
| 3512 | H | H | i-Pr | H | HO | Ph | 4-nPrNHCOC ₂ O-Ph | Me |
| 3513 | H | H | i-Pr | H | MeCO | Ph | 4-nPrNHCOC ₂ O-Ph | Me |
| 3514 | H | H | i-Pr | H | H ₂ NCO | Ph | 4-nPrNHCOC ₂ O-Ph | Me |
| 3515 | H | H | i-Pr | H | MeCOCH ₂ | Ph | 4-nPrNHCOC ₂ O-Ph | Me |
| 3516 | H | H | i-Pr | H | MeO ₂ CCH ₂ | Ph | 4-nPrNHCOC ₂ O-Ph | Me |
| 3517 | H | H | i-Pr | H | Me | Ph | 4-nPrNHCOC ₂ O-Ph | Et |
| 3518 | H | H | i-Pr | H | Me | Ph | 4-nPrNHCOC ₂ O-Ph | Pr |
| 3519 | H | H | 4-MeO-Ph | H | Me | Ph | 4-nPrNHCOC ₂ O-Ph | Me |
| 3520 | H | H | (2-pyridyl)CH ₂ NHCO-Ph | H | Me | Ph | 4-nPrNHCOC ₂ O-Ph | Me |
| 3521 | H | H | (3,4-methylenedioxyPh)-Ph | H | Me | Ph | 4-nPrNHCOC ₂ O-Ph | Me |

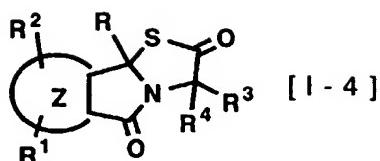
(表3 6)



| 化合物例 | R ¹ | R ² | R ³ | R ⁴ | Z | R |
|------|----------------|----------------|----------------|----------------|----|---|
| 4001 | H | H | i-Pr | H | Ph | 2-MeO-Ph |
| 4002 | H | H | i-Pr | H | Ph | Ph |
| 4003 | H | H | i-Pr | H | Ph | 2-NH ₂ -Ph |
| 4004 | H | H | i-Pr | H | Ph | 4-F-Ph |
| 4005 | H | H | i-Pr | H | Ph | 4-Et ₂ N-Ph |
| 4006 | H | H | i-Pr | H | Ph | 4-Cl-Ph |
| 4007 | H | H | i-Pr | H | Ph | 4-HO-Ph |
| 4008 | H | H | i-Pr | H | Ph | 3-MeO-Ph |
| 4009 | H | H | i-Pr | H | Ph | 3-HO-Ph |
| 4010 | H | H | i-Pr | H | Ph | 3-NH ₂ -Ph |
| 4011 | H | H | i-Pr | H | Ph | 4-MeO-Ph |
| 4012 | H | H | i-Pr | H | Ph | 4-Me-Ph |
| 4013 | H | H | i-Pr | H | Ph | 3-Me-Ph |
| 4014 | H | H | i-Pr | H | Ph | 4-tBuO ₂ CCH ₂ O-Ph |
| 4015 | H | H | i-Pr | H | Ph | 4-HO ₂ CCH ₂ O-Ph |
| 4016 | H | H | i-Pr | H | Ph | 4-tBuO ₂ C(CH ₂) ₅ O-Ph |
| 4017 | H | H | i-Pr | H | Ph | 4-HO ₂ C(CH ₂) ₅ O-Ph |
| 4018 | H | H | i-Pr | H | Ph | 4-HO(CH ₂) ₃ O-Ph |
| 4019 | H | H | i-Pr | H | Ph | 4-HO(CH ₂) ₂ O-Ph |
| 4020 | H | H | i-Pr | H | Ph | 4-HOC(Me) ₂ (CH ₂) ₂ O-Ph |
| 4021 | H | H | i-Pr | H | Ph | 4-PhCH ₂ O-Ph |
| 4022 | H | H | i-Pr | H | Ph | 4-MeNHCOCH ₂ O-Ph |
| 4023 | H | H | i-Pr | H | Ph | 4-EtNHCOCH ₂ O-Ph |

| | | | | | | |
|------|---|---|------|---|----|---|
| 4024 | H | H | i-Pr | H | Ph | 4-nPrNHCOCH ₂ O-Ph |
| 4025 | H | H | i-Pr | H | Ph | 4-nBuNHCOCH ₂ O-Ph |
| 4026 | H | H | i-Pr | H | Ph | 4-CH ₂ =CHCH ₂ NHCOCH ₂ O-Ph |
| 4027 | H | H | i-Pr | H | Ph | 4-Me(CH ₂) ₉ NHCOCH ₂ O-Ph |
| 4028 | H | H | i-Pr | H | Ph | 4-N ₃ (CH ₂) ₃ O-Ph |
| 4029 | H | H | i-Pr | H | Ph | 4-tBuO ₂ CCH(Me)O-Ph |
| 4030 | H | H | i-Pr | H | Ph | 4-nPrNHCOCH(Me)O-Ph |
| 4031 | H | H | i-Pr | H | Ph | 4-F ₃ CSO ₃ -Ph |
| 4032 | H | H | i-Pr | H | Ph | 4-tBuO ₂ CCH=CHPh |
| 4033 | H | H | i-Pr | H | Ph | 4-nPrNHCOCH=CH-Ph |
| 4034 | H | H | i-Pr | H | Ph | 4-nPrCH(Me)NHCOCH ₂ O-Ph |
| 4035 | H | H | i-Pr | H | Ph | 4-EtCH(Me)NHCOCH ₂ O-Ph |
| 4036 | H | H | i-Pr | H | Ph | 4-MeOCH ₂ O-Ph |
| 4037 | H | H | i-Pr | H | Ph | 4-EtCOCH ₂ O-Ph |
| 4038 | H | H | i-Pr | H | Ph | 3-tBuO ₂ CCH ₂ O-Ph |
| 4039 | H | H | i-Pr | H | Ph | 3-HO ₂ CCH ₂ O-Ph |
| 4040 | H | H | i-Pr | H | Ph | 3-nPrNHCOCH ₂ O-Ph |
| 4041 | H | H | i-Pr | H | Ph | 4-H ₂ NC(Me) ₂ CH ₂ O ₂ CCH ₂ O-Ph |
| 4042 | H | H | i-Pr | H | Ph | 4-morpholinoCOCH ₂ O-Ph |
| 4043 | H | H | i-Pr | H | Ph | 4-(4-Cl-Ph)-COCH ₂ O-Ph |
| 4044 | H | H | i-Pr | H | Ph | 4-PhCOCH ₂ O-Ph |
| 4045 | H | H | i-Pr | H | Ph | 4-(4-pyridyl)-CH ₂ NHCOCH ₂ O-Ph |
| 4046 | H | H | i-Pr | H | Ph | 4-H ₂ NCH ₂ CH ₂ NHCOCH ₂ O-Ph |

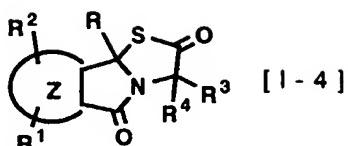
(表37)



| 化合物例 | R ¹ | R ² | R ³ | R ⁴ | Z | R |
|------|----------------|----------------|----------------|----------------|----|---|
| 4047 | H | H | i-Pr | H | Ph | 4-Cl-3-NO ₂ -Ph |
| 4048 | H | H | i-Pr | H | Ph | 4-Cl-3-F-Ph |
| 4049 | H | H | i-Pr | H | Ph | 4-Cl-3-Me-Ph |
| 4050 | H | H | i-Pr | H | Ph | 3-NH ₂ -4-Cl-Ph |
| 4051 | H | H | i-Pr | H | Ph | 3-Cl-4-MeO-Ph |
| 4052 | H | H | i-Pr | H | Ph | 3-Cl-4-Me-Ph |
| 4053 | H | H | i-Pr | H | Ph | 4-Br-3-Cl-Ph |
| 4054 | H | H | i-Pr | H | Ph | 4-Br-2-Cl-Ph |
| 4055 | H | H | i-Pr | H | Ph | 4-F-3-Me-Ph |
| 4056 | H | H | i-Pr | H | Ph | 3-F-4-Me-Ph |
| 4057 | H | H | i-Pr | H | Ph | 3-Br-4-HO-Ph |
| 4058 | H | H | i-Pr | H | Ph | 3-Br-4-MeO-Ph |
| 4059 | H | H | i-Pr | H | Ph | 3-Br-4-F-Ph |
| 4060 | H | H | i-Pr | H | Ph | 3-F-4-PhPh |
| 4061 | H | H | i-Pr | H | Ph | 4-HO-3-I-Ph |
| 4062 | H | H | i-Pr | H | Ph | 5-HO-2-I-Ph |
| 4063 | H | H | i-Pr | H | Ph | 3-I-4-MeO-Ph |
| 4064 | H | H | i-Pr | H | Ph | 2-I-5-MeO-Ph |
| 4065 | H | H | i-Pr | H | Ph | 4-MeO-3-Me-Ph |
| 4066 | H | H | i-Pr | H | Ph | 4-HO(CH ₂) ₃ O-3-I-Ph |
| 4067 | H | H | i-Pr | H | Ph | 4-HO(CH ₂) ₂ O-3-I-Ph |
| 4068 | H | H | i-Pr | H | Ph | 4-HOC(Me) ₂ (CH ₂) ₂ O-3-I-Ph |
| 4069 | H | H | i-Pr | H | Ph | 4-tBuO ₂ C(CH ₂) ₄ O-3-I-Ph |

| | | | | | | |
|------|---|---|------|---|----|---|
| 4070 | H | H | i-Pr | H | Ph | 3-I-4-PhCH ₂ O-Ph |
| 4071 | H | H | i-Pr | H | Ph | 4-H ₂ NCOCH ₂ O-3-I-Ph |
| 4072 | H | H | i-Pr | H | Ph | 3-I-4-MeNHCOCH ₂ O-Ph |
| 4073 | H | H | i-Pr | H | Ph | 4-EtNHCOCH ₂ O-3-I-Ph |
| 4074 | H | H | i-Pr | H | Ph | 3-I-4-nPrNHCOCH ₂ O-Ph |
| 4075 | H | H | i-Pr | H | Ph | 3-I-4-iPrNHCOCH ₂ O-Ph |
| 4076 | H | H | i-Pr | H | Ph | 4-nBuNHCOCH ₂ O-3-I-Ph |
| 4077 | H | H | i-Pr | H | Ph | 4-tBuNHCOCH ₂ O-3-I-Ph |
| 4078 | H | H | i-Pr | H | Ph | 4-iBuNHCOCH ₂ O-Ph |
| 4079 | H | H | i-Pr | H | Ph | 4-tBuO ₂ CCH ₂ O-3-I-Ph |
| 4080 | H | H | i-Pr | H | Ph | 3-I-4-PhCH ₂ NHCOCH ₂ O-Ph |
| 4081 | H | H | i-Pr | H | Ph | 3-I-4-(2-tetrahydrofuryl)CH ₂ NHCOCH ₂ O-Ph |
| 4082 | H | H | i-Pr | H | Ph | 4-cycloPrNHCOCH ₂ O-3-I-Ph |
| 4083 | H | H | i-Pr | H | Ph | 4-cycloPentyNHCOCH ₂ O-3-I-Ph |
| 4084 | H | H | i-Pr | H | Ph | 4-cycloHexylNHCOCH ₂ O-3-I-Ph |
| 4085 | H | H | i-Pr | H | Ph | 4-cycloPrNHCOCH ₂ O-3-F-Ph |
| 4086 | H | H | i-Pr | H | Ph | 4-Me(CH ₂) ₉ NHCOCH ₂ O-3-I-Ph |
| 4087 | H | H | i-Pr | H | Ph | 4-HO ₂ CCH ₂ O-3-I-Ph |
| 4088 | H | H | i-Pr | H | Ph | 4-N ₃ (CH ₂) ₃ O-3-I-Ph |
| 4089 | H | H | i-Pr | H | Ph | 3-I-4-nPrNHC(O)(CH ₂) ₄ O-Ph |
| 4090 | H | H | i-Pr | H | Ph | 4-Et ₂ NCOCH ₂ O-3-I-Ph |
| 4091 | H | H | i-Pr | H | Ph | 3-I-4-nPrN(Me)COCH ₂ O-Ph |
| 4092 | H | H | i-Pr | H | Ph | 3-Cl-4-nPrNHCOCH ₂ O-Ph |

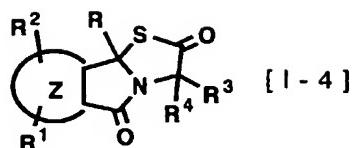
(表38)



| 化合物例 | R ¹ | R ² | R ³ | R ⁴ | Z | R |
|------|----------------|----------------|----------------|----------------|----|---|
| 4093 | H | H | i-Pr | H | Ph | 3-Br-4-nPrNHC ₂ O-Ph |
| 4094 | H | H | i-Pr | H | Ph | 3-F-4-nPrNHC ₂ O-Ph |
| 4095 | H | H | i-Pr | H | Ph | 3-Me-4-nPrNHC ₂ O-Ph |
| 4096 | H | H | i-Pr | H | Ph | 4-EtNHC ₂ O-3-F-Ph |
| 4097 | H | H | i-Pr | H | Ph | 3-I-4-iPrNHCOC(Me) ₂ CH ₂ O-Ph |
| 4098 | H | H | i-Pr | H | Ph | 3-Br-4-CH ₂ =CHCH ₂ NHC ₂ O-Ph |
| 4099 | H | H | i-Pr | H | Ph | 4-iBuNHC ₂ O-3-F-Ph |
| 4100 | H | H | i-Pr | H | Ph | 3-tBuO ₂ CCH=CH-4-nPrNHC ₂ O-Ph |
| 4101 | H | H | i-Pr | H | Ph | 3-HO ₂ CCH=CH-4-nPrNHC ₂ O-Ph |
| 4102 | H | H | i-Pr | H | Ph | 3-I-4-MeOCH ₂ CH ₂ NHC ₂ O-Ph |
| 4103 | H | H | i-Pr | H | Ph | 3-F-4-HO-Ph |
| 4104 | H | H | i-Pr | H | Ph | 3-F-4-MeO-Ph |
| 4105 | H | H | i-Pr | H | Ph | 3,4-methylenedioxyPh |
| 4106 | H | H | i-Pr | H | Ph | 3,4-ethylenedioxyPh |
| 4107 | H | H | i-Pr | H | Ph | 3,4-Cl ₂ -Ph |
| 4108 | H | H | i-Pr | H | Ph | 3,4-Me ₂ -Ph |
| 4109 | H | H | i-Pr | H | Ph | 3,4-F ₂ -Ph |
| 4110 | H | H | i-Pr | H | Ph | 3,4-(MeO) ₂ -Ph |
| 4111 | H | H | i-Pr | H | Ph | 3,5-(MeO) ₂ -Ph |
| 4112 | H | H | i-Pr | H | Ph | 3,5-Me ₂ -Ph |
| 4113 | H | H | i-Pr | H | Ph | 3,5-I ₂ -4-HO-Ph |
| 4114 | H | H | i-Pr | H | Ph | 2,4-I ₂ -5-HO-Ph |
| 4115 | H | H | i-Pr | H | Ph | 3,5-I ₂ -4-MeO-Ph |

| | | | | | | |
|------|---------------------|---|------|---|----|---|
| 4116 | H | H | i-Pr | H | Ph | 2,4-I ₂ -5-MeO-Ph |
| 4117 | H | H | i-Pr | H | Ph | 2,4,6-Me ₃ -Ph |
| 4118 | H | H | i-Pr | H | Ph | 4-HO(CH ₂) ₃ O-3,5-I ₂ Ph |
| 4119 | H | H | i-Pr | H | Ph | 3,5-I ₂ -4-nPrNHCOCH ₂ O-Ph |
| 4120 | H | H | i-Pr | H | Ph | 2-thienyl |
| 4121 | H | H | i-Pr | H | Ph | 2-furyl |
| 4122 | H | H | i-Pr | H | Ph | 3-pyridyl |
| 4123 | H | H | i-Pr | H | Ph | 2-naphthyl |
| 4124 | H | H | i-Pr | H | Ph | 5-F-1-naphthyl |
| 4125 | H | H | i-Pr | H | Ph | dibenzothiophene-2-yl |
| 4126 | 6-F | H | i-Pr | H | Ph | Ph |
| 4127 | 7-F | H | i-Pr | H | Ph | Ph |
| 4128 | 8-F | H | i-Pr | H | Ph | Ph |
| 4129 | 9-F | H | i-Pr | H | Ph | Ph |
| 4130 | 6-MeO | H | i-Pr | H | Ph | Ph |
| 4131 | 9-MeO | H | i-Pr | H | Ph | Ph |
| 4132 | 6-OH | H | i-Pr | H | Ph | Ph |
| 4133 | 9-OH | H | i-Pr | H | Ph | Ph |
| 4134 | 7-NO ₂ | H | i-Pr | H | Ph | Ph |
| 4135 | 8-NO ₂ | H | i-Pr | H | Ph | Ph |
| 4136 | 9-NO ₂ | H | i-Pr | H | Ph | Ph |
| 4137 | 6-NHPh | H | i-Pr | H | Ph | Ph |
| 4138 | 7-Me ₂ N | H | i-Pr | H | Ph | Ph |

(表39)

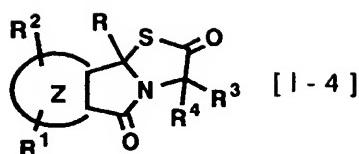


| 化合物例 | R ¹ | R ² | R ³ | R ⁴ | Z | R |
|------|----------------|----------------|----------------|----------------|--------------|----|
| 4139 | 7-Me | H | i-Pr | H | Ph | Ph |
| 4140 | 8-Me | H | i-Pr | H | Ph | Ph |
| 4141 | 7-t-Bu | H | i-Pr | H | Ph | Ph |
| 4142 | 8-t-Bu | H | i-Pr | H | Ph | Ph |
| 4143 | 7-Br | H | i-Pr | H | Ph | Ph |
| 4144 | 8-Br | H | i-Pr | H | Ph | Ph |
| 4145 | 7-Cl | H | i-Pr | H | Ph | Ph |
| 4146 | 8-Cl | H | i-Pr | H | Ph | Ph |
| 4147 | 7-Cl | 8-Cl | i-Pr | H | Ph | Ph |
| 4148 | 6-Cl | 9-Cl | i-Pr | H | Ph | Ph |
| 4149 | 6-OH | 9-I | i-Pr | H | Ph | Ph |
| 4150 | H | H | i-Pr | H | 1,2-naphthyl | Ph |
| 4151 | H | H | i-Pr | H | 2,3-naphthyl | Ph |
| 4152 | H | H | i-Pr | H | cyclohexenyl | Ph |
| 4153 | H | H | D-Leucine | H | Ph | Ph |
| 4154 | H | H | L-Leucine | H | Ph | Ph |
| 4155 | H | H | D-NorLeucine | H | Ph | Ph |
| 4156 | H | H | L-NorLeucine | H | Ph | Ph |
| 4157 | H | H | D-AlloLeucine | H | Ph | Ph |
| 4158 | H | H | L-AlloLeucine | H | Ph | Ph |
| 4159 | H | H | D-NorValine | H | Ph | Ph |
| 4160 | H | H | L-NorValine | H | Ph | Ph |
| 4161 | H | H | D-Alanine | H | Ph | Ph |

107/1

| | | | | | | |
|------|---|---|-----------------------|---|----|---------|
| 4162 | H | H | L-Alanine | H | Ph | Ph |
| 4163 | H | H | D-Arginine | H | Ph | Ph |
| 4164 | H | H | L-Arginine | H | Ph | Ph |
| 4165 | H | H | D-Asparagine | H | Ph | Ph |
| 4166 | H | H | L-Asparagine | H | Ph | Ph |
| 4167 | H | H | D-Glutamic Acid | H | Ph | Ph |
| 4168 | H | H | L-Glutamic Acid | H | Ph | Ph |
| 4169 | H | H | D-Glutamine | H | Ph | Ph |
| 4170 | H | H | L-Glutamine | H | Ph | Ph |
| 4171 | H | H | D-Histidine | H | Ph | Ph |
| 4172 | H | H | L-Histidine | H | Ph | Ph |
| 4173 | H | H | D-Methionine | H | Ph | Ph |
| 4174 | H | H | L-Methionine | H | Ph | Ph |
| 4175 | H | H | D-Tryptophan | H | Ph | Ph |
| 4176 | H | H | L-Tryptophan | H | Ph | Ph |
| 4177 | H | H | D-Tyrosine | H | Ph | Ph |
| 4178 | H | H | L-Tyrosine | H | Ph | Ph |
| 4179 | H | H | D- Homo Phenylalanine | H | Ph | Ph |
| 4180 | H | H | L- Homo Phenylalanine | H | Ph | Ph |
| 4181 | H | H | D-Leucine | H | Ph | 4-Cl-Ph |
| 4182 | H | H | L-Leucine | H | Ph | 4-Cl-Ph |
| 4183 | H | H | D- NorLeucine | H | Ph | 4-Cl-Ph |

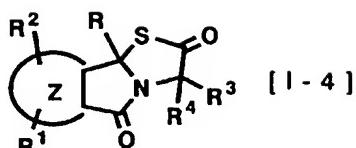
(表40)



| 化合物例 | R ¹ | R ² | R ³ | R ⁴ | Z | R |
|------|----------------|----------------|-----------------|----------------|----|---------|
| 4184 | H | H | L-NorLeucine | H | Ph | 4-Cl-Ph |
| 4185 | H | H | D-AlloLeucine | H | Ph | 4-Cl-Ph |
| 4186 | H | H | L-AlloLeucine | H | Ph | 4-Cl-Ph |
| 4187 | H | H | D-NorValine | H | Ph | 4-Cl-Ph |
| 4188 | H | H | L-NorValine | H | Ph | 4-Cl-Ph |
| 4189 | H | H | D-Alanine | H | Ph | 4-Cl-Ph |
| 4190 | H | H | L-Alanine | H | Ph | 4-Cl-Ph |
| 4191 | H | H | D-Arginine | H | Ph | 4-Cl-Ph |
| 4192 | H | H | L-Arginine | H | Ph | 4-Cl-Ph |
| 4193 | H | H | D-Asparagine | H | Ph | 4-Cl-Ph |
| 4194 | H | H | L-Asparagine | H | Ph | 4-Cl-Ph |
| 4195 | H | H | D-Glutamic Acid | H | Ph | 4-Cl-Ph |
| 4196 | H | H | L-Glutamic Acid | H | Ph | 4-Cl-Ph |
| 4197 | H | H | D-Glutamine | H | Ph | 4-Cl-Ph |
| 4198 | H | H | L-Glutamine | H | Ph | 4-Cl-Ph |
| 4199 | H | H | D-Histidine | H | Ph | 4-Cl-Ph |
| 4200 | H | H | L-Histidine | H | Ph | 4-Cl-Ph |
| 4201 | H | H | D-Methionine | H | Ph | 4-Cl-Ph |
| 4202 | H | H | L-Methionine | H | Ph | 4-Cl-Ph |
| 4203 | H | H | D-Tryptophan | H | Ph | 4-Cl-Ph |
| 4204 | H | H | L-Tryptophan | H | Ph | 4-Cl-Ph |
| 4205 | H | H | D-Tyrosine | H | Ph | 4-Cl-Ph |

| | | | | | | |
|------|---|---|---|----|----|--|
| 4206 | H | H | L-Tyrosine | H | Ph | 4-Cl-Ph |
| 4207 | H | H | D- Homo Phenylalanine | H | Ph | 4-Cl-Ph |
| 4208 | H | H | L- Homo Phenylalanine | H | Ph | 4-Cl-Ph |
| 4209 | H | H | t-Bu | H | Ph | Ph |
| 4210 | H | H | (CH ₃) ₂ (OH)C | H | Ph | Ph |
| 4211 | H | H | CH ₃ (MeO)CH | H | Ph | Ph |
| 4212 | H | H | 4-HO-Ph | H | Ph | Ph |
| 4213 | H | H | 4-HO-3-I-Ph | H | Ph | Ph |
| 4214 | H | H | 4-HO-3,5-I ₂ -Ph | H | Ph | Ph |
| 4215 | H | H | 4-HO-3-I-PhCH ₂ | H | Ph | Ph |
| 4216 | H | H | 4-HO-3,5-I ₂ -PhCH ₂ | H | Ph | Ph |
| 4217 | H | H | 1-naphthylmethyl | H | Ph | Ph |
| 4218 | H | H | 4-F-PhCH ₂ | H | Ph | Ph |
| 4219 | H | H | 1-naphthylmethyl | H | Ph | 4-Cl-Ph |
| 4220 | H | H | 4-F-PhCH ₂ | H | Ph | 4-Cl-Ph |
| 4221 | H | H | i-Pr | Me | Ph | 4-Cl-Ph |
| 4222 | H | H | Me | Me | Ph | Ph |
| 4223 | H | H | (R ⁴ と一緒になって)CH ₂ = | - | Ph | Ph |
| 4224 | H | H | (R ⁴ と一緒になって)MeCH | - | Ph | Ph |
| 4225 | H | H | (R ⁴ と一緒になって)(CH ₂) ₄ | - | Ph | Ph |
| 4226 | H | H | i-Pr | H | Ph | 4-n-PrNHCOCH ₂ CH ₂ O-Ph |
| 4227 | H | H | i-Pr | H | Ph | 4-i-PrNHCOCH ₂ CH ₂ O-Ph |
| 4228 | H | H | i-Pr | H | Ph | 4-EtNHCOCH ₂ CH ₂ O-Ph |

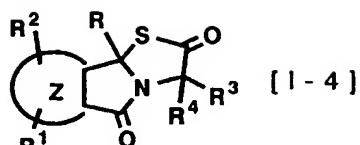
(表4 1)



| 化合物例 | R ¹ | R ² | R ³ | R ⁴ | Z | R |
|------|----------------|----------------|----------------|----------------|----|--|
| 4229 | H | H | i-Pr | H | Ph | 4-EtCH(Me)NHCOCH ₂ CH ₂ O-Ph |
| 4230 | H | H | i-Pr | H | Ph | 3-Cl-4-i-PrNHCOCH ₂ O-Ph |
| 4231 | H | H | i-Pr | H | Ph | 3-Cl-4-EtNHCOCH ₂ O-Ph |
| 4232 | H | H | i-Pr | H | Ph | 3-Cl-4-EtCH(Me)NHCOCH ₂ O-Ph |
| 4233 | H | H | i-Pr | H | Ph | 4-i-PrNHCOCH ₂ O-3-Me-Ph |
| 4234 | H | H | i-Pr | H | Ph | 4-EtNHCOCH ₂ O-3-Me-Ph |
| 4235 | H | H | i-Pr | H | Ph | 4-EtCH(Me)NHCOCH ₂ O-3-Me-Ph |
| 4236 | H | H | i-Pr | H | Ph | 4-cycloPrNHCOCH ₂ CH ₂ O-Ph |
| 4237 | H | H | i-Pr | H | Ph | 4-cycloPentyNHCOCH ₂ CH ₂ O-Ph |
| 4238 | H | H | i-Pr | H | Ph | 3-I-4-n-PrNHCOCH ₂ CH ₂ O-Ph |
| 4239 | H | H | i-Pr | H | Ph | 3-I-4-i-PrNHCOCH ₂ CH ₂ O-Ph |
| 4240 | H | H | i-Pr | H | Ph | 4-EtNHCOCH ₂ CH ₂ O-3-I-Ph |
| 4241 | H | H | i-Pr | H | Ph | 4-EtCH(Me)NHCOCH ₂ CH ₂ O-3-I-Ph |
| 4242 | H | H | i-Pr | H | Ph | 4-EtCOCH ₂ CH ₂ O-3-I-Ph |
| 4243 | H | H | i-Pr | H | Ph | 4-cycloPrNHCOCH ₂ CH ₂ O-3-I-Ph |
| 4244 | H | H | i-Pr | H | Ph | 4-cycloPentyNHCOCH ₂ CH ₂ O-3-I-Ph |
| 4245 | H | H | i-Pr | H | Ph | 3-F-4-n-PrNHCOCH ₂ CH ₂ O-Ph |
| 4246 | H | H | i-Pr | H | Ph | 3-F-4-i-PrNHCOCH ₂ CH ₂ O-Ph |
| 4247 | H | H | i-Pr | H | Ph | 4-EtNHCOCH ₂ CH ₂ O-3-F-Ph |
| 4248 | H | H | i-Pr | H | Ph | 4-EtCH(Me)NHCOCH ₂ CH ₂ O-3-F-Ph |
| 4249 | H | H | i-Pr | H | Ph | 4-EtCOCH ₂ CH ₂ O-3-F-Ph |
| 4250 | H | H | i-Pr | H | Ph | 3-F-4-i-BuNHCOCH ₂ CH ₂ O-Ph |

| | | | | | | |
|------|---|---|------|---|----|---|
| 4251 | H | H | i-Pr | H | Ph | 4-cycloPrNHCOCH ₂ CH ₂ O-3-F-Ph |
| 4252 | H | H | i-Pr | H | Ph | 3-Br-4-n-PrNHCOCH ₂ CH ₂ O-Ph |
| 4253 | H | H | i-Pr | H | Ph | 3-Br-4-i-PrNHCOCH ₂ CH ₂ O-Ph |
| 4254 | H | H | i-Pr | H | Ph | 3-Br-4-EtNHCOCH ₂ CH ₂ O-Ph |
| 4255 | H | H | i-Pr | H | Ph | 3-Br-4-i-BuNHCOCH ₂ CH ₂ O-Ph |
| 4256 | H | H | i-Pr | H | Ph | 3-Cl-4-n-PrNHCOCH ₂ CH ₂ O-Ph |
| 4257 | H | H | i-Pr | H | Ph | 3-Cl-4-i-PrNHCOCH ₂ CH ₂ O-Ph |
| 4258 | H | H | i-Pr | H | Ph | 3-Cl-4-EtNHCOCH ₂ CH ₂ O-Ph |
| 4259 | H | H | i-Pr | H | Ph | 3-Cl-4-EtCH(Me)NHCOCH ₂ CH ₂ O-Ph |
| 4260 | H | H | i-Pr | H | Ph | 3-Cl-4-cycloPrNHCOCH ₂ CH ₂ O-Ph |
| 4261 | H | H | i-Pr | H | Ph | 3-Cl-4-cycloPentyNHCOCH ₂ CH ₂ O-Ph |
| 4262 | H | H | i-Pr | H | Ph | 3-Me-4-n-PrNHCOCH ₂ CH ₂ O-Ph |
| 4263 | H | H | i-Pr | H | Ph | 4-i-PrNHCOCH ₂ CH ₂ O-3-Me-Ph |
| 4264 | H | H | i-Pr | H | Ph | 4-EtNHCOCH ₂ CH ₂ O-3-Me-Ph |
| 4265 | H | H | i-Pr | H | Ph | 3-Me-4-MeNHCOCH ₂ CH ₂ O-Ph |
| 4266 | H | H | i-Pr | H | Ph | 3-Me-4-n-BuNHCOCH ₂ CH ₂ O-Ph |
| 4267 | H | H | i-Pr | H | Ph | 4-EtCH(Me)NHCOCH ₂ CH ₂ O-3-Me-Ph |
| 4268 | H | H | i-Pr | H | Ph | 4-EtCOCH ₂ CH ₂ O-3-Me-Ph |
| 4269 | H | H | i-Pr | H | Ph | 4-i-BuNHCOCH ₂ CH ₂ O-3-Me-Ph |
| 4270 | H | H | i-Pr | H | Ph | 3-Me-4-t-BuNHCOCH ₂ CH ₂ O-Ph |
| 4271 | H | H | i-Pr | H | Ph | 4-cycloPrNHCOCH ₂ CH ₂ O-3-Me-Ph |
| 4272 | H | H | i-Pr | H | Ph | 4-cycloPentyNHCOCH ₂ CH ₂ O-3-Me-Ph |
| 4273 | H | H | Me | H | Ph | 3-Cl-4-n-PrNHCOCH ₂ O-Ph |

(表42)

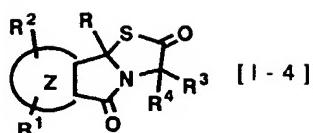


| 化合物例 | R¹ | R² | R³ | R⁴ | Z | R |
|------|---------------|---------------|---------------|---------------|----|--|
| 4274 | H | H | Me | H | Ph | 3-Cl-4-i-PrNHCOCH ₂ O-Ph |
| 4275 | H | H | Me | H | Ph | 3-Cl-4-EtNHCOCH ₂ O-Ph |
| 4276 | H | H | Me | H | Ph | 3-Cl-4-EtCH(Me)NHCOCH ₂ O-Ph |
| 4277 | H | H | Me | H | Ph | 3-Cl-4-cycloPrNHCOCH ₂ O-Ph |
| 4278 | H | H | Me | H | Ph | 3-Cl-4-cycloPentylNHCOCH ₂ O-Ph |
| 4279 | H | H | Et | H | Ph | 3-Me-4-n-PrNHCOCH ₂ O-Ph |
| 4280 | H | H | Et | H | Ph | 4-i-PrNHCOCH ₂ O-3-Me-Ph |
| 4281 | H | H | Et | H | Ph | 4-EtNHCOCH ₂ O-3-Me-Ph |
| 4282 | H | H | Et | H | Ph | 3-Me-4-MeNHCOCH ₂ O-Ph |
| 4283 | H | H | Et | H | Ph | 3-Me-4-n-BuNHCOCH ₂ O-Ph |
| 4284 | H | H | Et | H | Ph | 4-EtCH(Me)NHCOCH ₂ O-3-Me-Ph |
| 4285 | H | H | Et | H | Ph | 4-EtCOCH ₂ O-3-Me-Ph |
| 4286 | H | H | Et | H | Ph | 4-i-BuNHCOCH ₂ O-3-Me-Ph |
| 4287 | H | H | Pr | H | Ph | 3-Cl-4-n-PrNHCOCH ₂ O-Ph |
| 4288 | H | H | Pr | H | Ph | 3-Cl-4-i-PrNHCOCH ₂ O-Ph |
| 4289 | H | H | Pr | H | Ph | 3-Cl-4-EtNHCOCH ₂ O-Ph |
| 4290 | H | H | Pr | H | Ph | 3-Cl-4-EtCH(Me)NHCOCH ₂ O-Ph |
| 4291 | H | H | Pr | H | Ph | 3-Cl-4-cycloPrNHCOCH ₂ O-Ph |
| 4292 | H | H | Pr | H | Ph | 3-Cl-4-cycloPentylNHCOCH ₂ O-Ph |
| 4293 | H | H | Bu | H | Ph | 3-Me-4-n-PrNHCOCH ₂ O-Ph |
| 4294 | H | H | Bu | H | Ph | 4-i-PrNHCOCH ₂ O-3-Me-Ph |
| 4295 | H | H | Bu | H | Ph | 4-EtNHCOCH ₂ O-3-Me-Ph |

110/1

| | | | | | | |
|------|---|---|-------------------|----|----|---|
| 4296 | H | H | Bu | H | Ph | 3-Me-4-MeNHCOCH ₂ O-Ph |
| 4297 | H | H | Bu | H | Ph | 3-Me-4-n-BuNHCOCH ₂ O-Ph |
| 4298 | H | H | Bu | H | Ph | 4-EtCH(Me)NHCOCH ₂ O-3-Me-Ph |
| 4299 | H | H | Bu | H | Ph | 4-EtCOCH ₂ O-3-Me-Ph |
| 4300 | H | H | Bu | H | Ph | 4-i-BuNHCOCH ₂ O-3-Me-Ph |
| 4301 | H | H | i-Bu | H | Ph | 3-Cl-4-n-PrNHCOCH ₂ O-Ph |
| 4302 | H | H | i-Bu | H | Ph | 3-Cl-4-i-PrNHCOCH ₂ O-Ph |
| 4303 | H | H | i-Bu | H | Ph | 3-Cl-4-EtNHCOCH ₂ O-Ph |
| 4304 | H | H | i-Bu | H | Ph | 3-Cl-4-EtCH(Me)NHCOCH ₂ O-Ph |
| 4305 | H | H | i-Bu | H | Ph | 3-Cl-4-cycloPrNHCOCH ₂ O-Ph |
| 4306 | H | H | i-Bu | H | Ph | 3-Cl-4-cycloPentyNHCOCH ₂ O-Ph |
| 4307 | H | H | t-Bu | H | Ph | 3-Me-4-n-PrNHCOCH ₂ O-Ph |
| 4308 | H | H | t-Bu | H | Ph | 4-i-PrNHCOCH ₂ O-3-Me-Ph |
| 4309 | H | H | t-Bu | H | Ph | 4-EtNHCOCH ₂ O-3-Me-Ph |
| 4310 | H | H | t-Bu | H | Ph | 3-Me-4-MeNHCOCH ₂ O-Ph |
| 4311 | H | H | PhCH ₂ | H | Ph | 3-Me-4-n-BuNHCOCH ₂ O-Ph |
| 4312 | H | H | PhCH ₂ | H | Ph | 4-EtCH(Me)NHCOCH ₂ O-3-Me-Ph |
| 4313 | H | H | PhCH ₂ | H | Ph | 4-EtCOCH ₂ O-3-Me-Ph |
| 4314 | H | H | PhCH ₂ | H | Ph | 4-i-BuNHCOCH ₂ O-3-Me-Ph |
| 4315 | H | H | i-Pr | Me | Ph | 3-Cl-4-n-PrNHCOCH ₂ O-Ph |
| 4316 | H | H | i-Pr | Me | Ph | 3-Cl-4-i-PrNHCOCH ₂ O-Ph |
| 4317 | H | H | i-Pr | Me | Ph | 3-Cl-4-EtNHCOCH ₂ O-Ph |
| 4318 | H | H | i-Pr | Me | Ph | 3-Cl-4-EtCH(Me)NHCOCH ₂ O-Ph |

(表4 3)

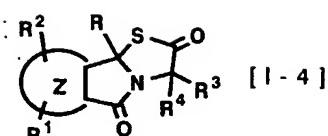


| 化合物例 | R ¹ | R ² | R ³ | R ⁴ | Z | R |
|------|----------------|----------------|----------------|----------------|-------------|---|
| 4319 | H | H | i-Pr | Me | Ph | 3-Cl-4-cycloPrNHCOCH ₂ O-Ph |
| 4320 | H | H | i-Pr | Me | Ph | 3-Cl-4-cycloPentyNHCOCH ₂ O-Ph |
| 4321 | H | H | i-Pr | H | 2,3-Pyridyl | 3-Me-4-n-PrNHCOCH ₂ O-Ph |
| 4322 | H | H | i-Pr | H | 2,3-Pyridyl | 4-i-PrNHCOCH ₂ O-3-Me-Ph |
| 4323 | H | H | i-Pr | H | 2,3-Pyridyl | 4-EtNHCOCH ₂ O-3-Me-Ph |
| 4324 | H | H | i-Pr | H | 2,3-Pyridyl | 3-Me-4-MeNHCOCH ₂ O-Ph |
| 4325 | H | H | i-Pr | H | 2,3-Pyridyl | 3-Me-4-n-BuNHCOCH ₂ O-Ph |
| 4326 | H | H | i-Pr | H | 2,3-Pyridyl | 4-EtCH(Me)NHCOCH ₂ O-3-Me-Ph |
| 4327 | H | H | i-Pr | H | 2,3-Pyridyl | 4-EtCOCH ₂ O-3-Me-Ph |
| 4328 | H | H | i-Pr | H | 2,3-Pyridyl | 4-i-BuNHCOCH ₂ O-3-Me-Ph |
| 4329 | H | H | i-Pr | H | 2,3-Pyridyl | 3-Cl-4-n-PrNHCOCH ₂ O-Ph |
| 4330 | H | H | i-Pr | H | 3,4-Pyridyl | 3-Cl-4-i-PrNHCOCH ₂ O-Ph |
| 4331 | H | H | i-Pr | H | 3,4-Pyridyl | 3-Cl-4-EtNHCOCH ₂ O-Ph |
| 4332 | H | H | i-Pr | H | 3,4-Pyridyl | 3-Cl-4-EtCH(Me)NHCOCH ₂ O-Ph |
| 4333 | H | H | i-Pr | H | 3,4-Pyridyl | 3-Cl-4-cycloPrNHCOCH ₂ O-Ph |
| 4334 | H | H | i-Pr | H | 3,4-Pyridyl | 3-Cl-4-cycloPentyNHCOCH ₂ O-Ph |
| 4335 | H | H | i-Pr | H | Ph | 4-F-5-n-PrNHCOCH ₂ O-(2-pyridyl) |
| 4336 | H | H | i-Pr | H | Ph | 4-F-5-i-PrNHCOCH ₂ O-(2-pyridyl) |
| 4337 | H | H | i-Pr | H | Ph | 4-EtNHCOCH ₂ O-3-F-(2-pyridyl) |
| 4338 | H | H | i-Pr | H | Ph | 4-EtCH(Me)NHCOCH ₂ O-3-F-(2-pyridyl) |
| 4339 | H | H | i-Pr | H | Ph | 4-EtCOCH ₂ O-3-F-(2-pyridyl) |
| 4340 | H | H | i-Pr | H | Ph | 3-F-4-i-BuNHCOCH ₂ O-(2-pyridyl) |
| 4341 | H | H | i-Pr | H | Ph | 4-cycloPrNHCOCH ₂ O-3-F-(2-pyridyl) |

111/1

| | | | | | | |
|------|---|---|------|---|----|---|
| 4342 | H | H | i-Pr | H | Ph | 5-I-6-n-PrNHCOCH ₂ O-(3-pyridyl) |
| 4343 | H | H | i-Pr | H | Ph | 5-I-6-i-PrNHCOCH ₂ O-(3-pyridyl) |
| 4344 | H | H | i-Pr | H | Ph | 6-EtNHCOCH ₂ O-5-I-(3-pyridyl) |
| 4345 | H | H | i-Pr | H | Ph | 6-EtCH(Me)NHCOCH ₂ O-5-I-(3-pyridyl) |
| 4346 | H | H | i-Pr | H | Ph | 6-EtCOCH ₂ O-5-I-(3-pyridyl) |
| 4347 | H | H | i-Pr | H | Ph | 6-cycloPrNHCOCH ₂ O-5-I-(3-pyridyl) |
| 4348 | H | H | i-Pr | H | Ph | 3-NO ₂ -4-n-PrNHCOCH ₂ O-Ph |
| 4349 | H | H | i-Pr | H | Ph | 3-NO ₂ -4-i-PrNHCOCH ₂ O-Ph |
| 4350 | H | H | i-Pr | H | Ph | 4-EtNHCOCH ₂ O-3-NO ₂ -Ph |
| 4351 | H | H | i-Pr | H | Ph | 4-EtCH(Me)NHCOCH ₂ O-3-NO ₂ -Ph |
| 4352 | H | H | i-Pr | H | Ph | 4-EtCOCH ₂ O-3-NO ₂ -Ph |
| 4353 | H | H | i-Pr | H | Ph | 4-i-BuNHCOCH ₂ O-3-NO ₂ -Ph |
| 4354 | H | H | i-Pr | H | Ph | 4-cycloPrNHCOCH ₂ O-3-NO ₂ -Ph |
| 4355 | H | H | i-Pr | H | Ph | 3-MeO-4-n-PrNHCOCH ₂ O-Ph |
| 4356 | H | H | i-Pr | H | Ph | 3-MeO-4-i-PrNHCOCH ₂ O-Ph |
| 4357 | H | H | i-Pr | H | Ph | 4-EtNHCOCH ₂ O-3-MeO-Ph |
| 4358 | H | H | i-Pr | H | Ph | 4-EtCH(Me)NHCOCH ₂ O-3-MeO-Ph |
| 4359 | H | H | i-Pr | H | Ph | 4-EtCOCH ₂ O-3-MeO-Ph |
| 4360 | H | H | i-Pr | H | Ph | 3-MeO-4-i-BuNHCOCH ₂ O-Ph |
| 4361 | H | H | i-Pr | H | Ph | 4-cycloPrNHCOCH ₂ O-3-MeO-Ph |
| 4362 | H | H | i-Pr | H | Ph | 3-HO-4-n-PrNHCOCH ₂ O-Ph |
| 4363 | H | H | i-Pr | H | Ph | 3-HO-4-i-PrNHCOCH ₂ O-Ph |

(表44)



| 化合物例 | R ¹ | R ² | R ³ | R ⁴ | Z | R |
|------|----------------|----------------|----------------|----------------|----|---|
| 4364 | H | H | i-Pr | H | Ph | 4-EtNHCOCH ₂ O-3-HO-Ph |
| 4365 | H | H | i-Pr | H | Ph | 4-EtCH(Me)NHCOCH ₂ O-3-HO-Ph |
| 4366 | H | H | i-Pr | H | Ph | 4-EtCOCH ₂ O-3-HO-Ph |
| 4367 | H | H | i-Pr | H | Ph | 3-HO-4-i-BuNHCOCH ₂ O-Ph |
| 4368 | H | H | i-Pr | H | Ph | 4-cycloPrNHCOCH ₂ O-3-HO-Ph |
| 4369 | H | H | i-Pr | H | Ph | 3-H ₂ NCH ₂ CH ₂ NHCOCH ₂ O-Ph |
| 4370 | H | H | i-Pr | H | Ph | 2-H ₂ NCH ₂ CH ₂ NHCOCH ₂ O-Ph |
| 4371 | H | H | i-Pr | H | Ph | 4-MeNHCH ₂ CH ₂ NHCOCH ₂ O-Ph |
| 4372 | H | H | i-Pr | H | Ph | 3-MeNHCH ₂ CH ₂ NHCOCH ₂ O-Ph |
| 4373 | H | H | i-Pr | H | Ph | 2-MeNHCH ₂ CH ₂ NHCOCH ₂ O-Ph |
| 4374 | H | H | i-Pr | H | Ph | 4-Me ₂ NCH ₂ CH ₂ NHCOCH ₂ O-Ph |
| 4375 | H | H | i-Pr | H | Ph | 3-Me ₂ NCH ₂ CH ₂ NHCOCH ₂ O-Ph |
| 4376 | H | H | i-Pr | H | Ph | 2-Me ₂ NCH ₂ CH ₂ NHCOCH ₂ O-Ph |
| 4377 | H | H | i-Pr | H | Ph | 4-H ₂ NCH ₂ CH ₂ NHCOCH ₂ O-3-Cl-Ph |
| 4378 | H | H | i-Pr | H | Ph | 3-H ₂ NCH ₂ CH ₂ NHCOCH ₂ O-4-Cl-Ph |
| 4379 | H | H | i-Pr | H | Ph | 2-H ₂ NCH ₂ CH ₂ NHCOCH ₂ O-4-Cl-Ph |
| 4380 | H | H | i-Pr | H | Ph | 4-MeNHCH ₂ CH ₂ NHCOCH ₂ O-3-Me-Ph |
| 4381 | H | H | i-Pr | H | Ph | 3-MeNHCH ₂ CH ₂ NHCOCH ₂ O-4-Me-Ph |
| 4382 | H | H | i-Pr | H | Ph | 2-MeNHCH ₂ CH ₂ NHCOCH ₂ O-4-MePh |
| 4383 | H | H | i-Pr | H | Ph | 4-Me ₂ NCH ₂ CH ₂ NHCOCH ₂ O-3-F-Ph |
| 4384 | H | H | i-Pr | H | Ph | 3-Me ₂ NCH ₂ CH ₂ NHCOCH ₂ O-4-F-Ph |
| 4385 | H | H | i-Pr | H | Ph | 2-Me ₂ NCH ₂ CH ₂ NHCOCH ₂ O-4-F-Ph |
| 4386 | H | H | i-Pr | H | Ph | 4-H ₂ NCOCH ₂ -3-I-Ph |

| | | | | | | |
|------|---|---|------|---|----|--|
| 4387 | H | H | i-Pr | H | Ph | 3-I-4-MeNHCOCH ₂ -Ph |
| 4388 | H | H | i-Pr | H | Ph | 4-EtNHCOCH ₂ -3-I-Ph |
| 4389 | H | H | i-Pr | H | Ph | 3-I-4-nPrNHCOCH ₂ -Ph |
| 4390 | H | H | i-Pr | H | Ph | 3-I-4-iPrNHCOCH ₂ -Ph |
| 4391 | H | H | i-Pr | H | Ph | 4-nBuNHCOCH ₂ -3-I-Ph |
| 4392 | H | H | i-Pr | H | Ph | 4-tBuNHCOCH ₂ -3-I-Ph |
| 4393 | H | H | i-Pr | H | Ph | 4-iBuNHCOCH ₂ -Ph |
| 4394 | H | H | i-Pr | H | Ph | 4-tBuO ₂ CCH ₂ -3-I-Ph |
| 4395 | H | H | i-Pr | H | Ph | 3-I-4-PhCH ₂ NHCOCH ₂ -Ph |
| 4396 | H | H | i-Pr | H | Ph | 3-I-4-(2-tetrahydrofuryl)CH ₂ NHCOCH ₂ -Ph |
| 4397 | H | H | i-Pr | H | Ph | 4-cycloPrNHCOCH ₂ -3-I-Ph |
| 4398 | H | H | i-Pr | H | Ph | 4-cycloPentyNHCOCH ₂ -3-I-Ph |
| 4399 | H | H | i-Pr | H | Ph | 4-cycloHexylNHCOCH ₂ -3-I-Ph |
| 4400 | H | H | i-Pr | H | Ph | 4-cycloPrNHCOCH ₂ -3-F-Ph |
| 4401 | H | H | i-Pr | H | Ph | 3-Cl-4-i-PrNHCOCH ₂ CH ₂ -Ph |
| 4402 | H | H | i-Pr | H | Ph | 3-Cl-4-EtNHCOCH ₂ CH ₂ -Ph |
| 4403 | H | H | i-Pr | H | Ph | 3-Cl-4-EtCH(Me)NHCOCH ₂ CH ₂ -Ph |
| 4404 | H | H | i-Pr | H | Ph | 4-i-PrNHCO-3-Me-Ph |
| 4405 | H | H | i-Pr | H | Ph | 4-EtNHCO-3-Me-Ph |
| 4406 | H | H | i-Pr | H | Ph | 4-EtCH(Me)NHCO-3-Me-Ph |
| 4407 | H | H | i-Pr | H | Ph | 3-Cl-4-i-PrNHCH ₂ CH ₂ O-Ph |
| 4408 | H | H | i-Pr | H | Ph | 3-Cl-4-EtNHCH ₂ CH ₂ O-Ph |
| 4409 | H | H | i-Pr | H | Ph | 3-Cl-4-EtCH(Me)NHCH ₂ CH ₂ O-Ph |

(表45)

| 化合物例 | R ¹ | R ² | R ³ | R ⁴ | Z | R |
|------|----------------|----------------|------------------------------------|----------------|---|-------------------------------|
| | | | | | [1 - 4] | |
| 4410 | H | H | i-Pr | H | 4,5-pyridazinyl | 4-nPrNHCOCH ₂ O-Ph |
| 4411 | H | H | i-Pr | H | 5,6-benztrizoyl | 4-nPrNHCOCH ₂ O-Ph |
| 4412 | H | H | i-Pr | H | 1,2-cyclohexyl | 4-nPrNHCOCH ₂ O-Ph |
| 4413 | H | H | i-Pr | H | 6,7-phthalazinyl | 4-nPrNHCOCH ₂ O-Ph |
| 4414 | H | H | i-Pr | H | 6,7-quinoxalinyl | 4-nPrNHCOCH ₂ O-Ph |
| 4415 | | | i-Pr | Ph | 3-PhSO ₂ -4-nPrNHCOCH ₂ O-Ph | |
| 4416 | | | i-Pr | Ph | 3-EtNH ₂ -4-nPrNHCOCH ₂ O-Ph | |
| 4417 | | | i-Pr | Ph | 3-Me-4-nPrNHCOCH ₂ S-Ph | |
| 4418 | | | i-Pr | Ph | 3-Me-4-Et ₂ NCOCH ₂ S-Ph | |
| 4419 | | | i-Pr | Ph | 4-nPrNHCOCH ₂ O-pyrazin-2-yl | |
| 4420 | | | i-Pr | Ph | 3-(2,5-Pyrazinyl)-4-nPrNHCOCH ₂ O-Ph | |
| 4421 | | | i-Pr | Ph | 3-(3,4-methylenedioxyPh)-4-EtNHCOCH ₂ O-Ph | |
| 4422 | | | i-Pr | Ph | 3-Me-4-nPrNHCOCH ₂ NH-Ph | |
| 4423 | | | i-Pr | Ph | 3-Me-4-nPrNHCOCH ₂ S-Ph | |
| 4424 | | | i-Pr | Ph | 3-Cl-4-HO-Ph | |
| 4425 | | | n-PrNHCS-PhCH ₂ | Ph | 4-nPrNHCOCH ₂ O-Ph | |
| 4426 | | | (3-thienyl)CH ₂ | H | 4-nPrNHCOCH ₂ O-Ph | |
| 4427 | | | 3,4-ethylenedioxyPhCH ₂ | H | 4-nPrNHCOCH ₂ O-Ph | |

これらの化合物の内、好適な化合物は、例えば1002、1011、1014、1023、1024、1033、1035、1037、1046、1050、1056、1063、1070、1071、1072、1073、1074、1075、1076、1077、1078、1081、1082、1083、1085、1091、1092、1093、1094、1095、1096、1098、1102、1104、1107、1119、1122、1126、1129、1130、1137、1150、1152、1182、1183、1184、1185、1209、1210、1219、1251、1257、1268、1276、1285、1295、1310、1316、1413、1426、1429、1430、1432、1433、1435、1328、1333、1338、1348、1356、1364、1371、1380、1383、1388、1391、1404、2002、2011、2023、2024、2050、2056、2074、2092、2094、2096、2251、2268、2285、2295、2316、2333、2348、2364、2380、2388、2

391、2410、2422、2456、2462、2467、2468、24
71、2474、2476、3001、3002、3007、3011、301
4、3015、3020、3023、3024、3033、3039、3047、
3050、3051、3056、3057、3058、3063、3065、3
5 072、3073、3074、3076、3078、3082、3083、30
92、3093、3094、3095、3096、3103、3104、310
7、3117、3226、3241、3246、3258、3266、3296、
3307、3319、3412、3418、3464、3468、3471、3
475、3476、3477、3479、3480、3481、3482、34
10 84、3485、3486、3487、3488、3489、3492、349
3、3495、3499、3500、3501、3505、3506、3509、
3510、3511、3513、3515、3516、3517、3518、4
002、4011、4023、4024、4050、4056、4063、40
73、4074、4092、4094、4096、4257、4276、429
15 5、4316、4333、4348、4364、4380、4388、4404、
4410、4416、4417、4419、4420等であり、中でも例えば1
002、1014、1024、1033、1050、1063、1071、10
72、1073、1074、1075、1076、1078、1081、108
2、1083、1091、1092、1093、1094、1095、1098、
20 1102、1104、1209、1429、1430、1432、1433、1
435、2002、2011、2050、2074、2094、2268、22
95、2333、2364、2380、2391、2410、2422、245
6、2462、2471、3001、3002、3007、3011、3014、
3015、3024、3050、3056、3063、3074、3078、3
25 082、3092、3093、3094、3095、3103、3104、34
75、3476、3477、3479、3480、3481、3482、348
8、3489、3499、3511、4002、4011、4050、4063、
4073、4074、4094、4257、4295、4333、4348、4
380、4388、4404の化合物等が好ましい。

- 特に、2-(4-(3-イソプロピル-2,5-ジオキソ-2,3-ジヒドロ[1,3]オキサゾロ[2,3-a]イソインドール-9(5H)-イル)フェノキシ)-N-プロピルアセトアミド(1024の化合物)、
 9b-(3-ヨード-4-メトキシフェニル)-3-イソプロピル[1,3]オキサゾロ[2,3-a]イソインドール-2,5(3H,9bH)-ジオン(1063の化合物)、
 2-(2-ヨード-4-(3-イソプロピル-2,5-ジオキソ-2,3-ジヒドロ[1,3]オキサゾロ[2,3-a]イソインドール-9(5H)-イル)フェノキシ)-N-メチルアセトアミド(1072の化合物)、
 10 N-エチル-2-(2-ヨード-4-(3-イソプロピル-2,5-ジオキソ-2,3-ジヒドロ[1,3]オキサゾロ[2,3-a]イソインドール-9(5H)-イル)フェノキシ)アセトアミド(1073の化合物)、
 2-(2-ヨード-4-(3-イソプロピル-2,5-ジオキソ-2,3-ジヒドロ[1,3]オキサゾロ[2,3-a]イソインドール-9(5H)-イル)フェノキシ)-N-プロピルアセトアミド(1074の化合物)、
 2-(2-クロロ-4-(3-イソプロピル-2,5-ジオキソ-2,3-ジヒドロ[1,3]オキサゾロ[2,3-a]イソインドール-9(5H)-イル)フェノキシ)-N-プロピルアセトアミド(1092の化合物)、
 2-(2-ブロモ-4-(3-イソプロピル-2,5-ジオキソ-2,3-ジヒドロ[1,3]オキサゾロ[2,3-a]イソインドール-9(5H)-イル)フェノキシ)-N-プロピルアセトアミド(1093の化合物)、
 2-(2-フルオロ-4-(3-イソプロピル-2,5-ジオキソ-2,3-ジヒドロ[1,3]オキサゾロ[2,3-a]イソインドール-9(5H)-イル)フェノキシ)-N-プロピルアセトアミド(1094の化合物)、
 25 2-(4-(3-イソプロピル-2,5-ジオキソ-2,3-ジヒドロ[1,3]オキサゾロ[2,3-a]イソインドール-9(5H)-イル)-2-メチルフェノキシ)-N-プロピルアセトアミド(1095の化合物)、
 2-(2-エチル-4-(3-イソプロピル-2,5-ジオキソ-2,3-ジヒドロ[1,3]オキサゾロ[2,3-a]イソインドール-9(5H)-イル)

- フェノキシ) -N-プロピルアセトアミド (1435の化合物)、
 2-(2-ヨード-4-(3-イソプロピル-2, 5-ジオキソ-2, 3-ジヒドロ-1H-イミダゾ[2, 1-a]イソインドール-9(5H)-イル)フェノキシ) -N-プロピルアセトアミド (2074の化合物)、
 5 2-(4-(3-イソプロピル-1-メチル-2, 5-ジオキソ-2, 3-ジヒドロ-1H-イミダゾ[2, 1-a]イソインドール-9(5H)-イル)フェノキシ) -N-プロピルアセトアミド (2471の化合物)、
 3-イソプロピル-9b-(4-メトキシフェニル)-1H-ピロロ[2, 1-a]イソインドール-2, 5(3H, 9bH)-ジオン (3011の化合物)、
 10 2-(4-(3-イソプロピル-2, 5-ジオキソ-2, 3-ジヒドロ-1H-ピロロ[2, 1-a]イソインドール-9(5H)-イル)フェノキシ) -N-プロピルアセトアミド (3024の化合物)、
 9b-(3-フルオロー-4-メチルフェニル)-3-イソプロピル-1H-ピロロ[2, 1-a]イソインドール-2, 5(3H, 9bH)-ジオン (3056の化合物)、
 15 2-(2-ヨード-4-(3-イソプロピル-2, 5-ジオキソ-2, 3-ジヒドロ-1H-ピロロ[2, 1-a]イソインドール-9(5H)-イル)フェノキシ) -N-プロピルアセトアミド (3074の化合物)、
 2-(2-クロロ-4-(3-イソプロピル-2, 5-ジオキソ-2, 3-ジヒドロ-1H-ピロロ[2, 1-a]イソインドール-9(5H)-イル)フェノキシ) -N-プロピルアセトアミド (3092の化合物)、
 20 2-(2-ブロモ-4-(3-イソプロピル-2, 5-ジオキソ-2, 3-ジヒドロ-1H-ピロロ[2, 1-a]イソインドール-9(5H)-イル)フェノキシ) -N-プロピルアセトアミド (3093の化合物)、
 25 2-(2-フルオロー-4-(3-イソプロピル-2, 5-ジオキソ-2, 3-ジヒドロ-1H-ピロロ[2, 1-a]イソインドール-9(5H)-イル)フェノキシ) -N-プロピルアセトアミド (3094の化合物)、
 2-(4-(3-イソプロピル-2, 5-ジオキソ-2, 3-ジヒドロ-1H-ピロロ[2, 1-a]イソインドール-9(5H)-イル)-2-メチルフェノ

- キシ) -N-プロピルアセトアミド(3095の化合物)、
 2-(4-(3-イソプロピル-2, 5-ジオキソ-2, 3-ジヒドロ-1H-ピロロ[2, 1-a]イソインドール-9(5H)-イル)-2-メチルフェノキシ)-N-プロピルエタンチオアミド(3476の化合物)、
- 5 2-(2, 6-ジクロロ-4-(3-イソプロピル-2, 5-ジオキソ-2, 3-ジヒドロ-1H-ピロロ[2, 1-a]イソインドール-9(5H)-イル)フェノキシ)-N-プロピルエタンチオアミド(3477の化合物)、
 2-(4-(3-イソプロピル-1-メチル-2, 5-ジオキソ-2, 3-ジヒドロ-1H-ピロロ[2, 1-a]イソインドール-9(5H)-イル)フェノ
- 10 キシ)-N-プロピルアセトアミド(3481の化合物)、
 2-(2, 6-ジクロロ-4-(3-イソプロピル-2-オキソ-5-チオキソ-2, 3-ジヒドロ-1H-ピロロ[2, 1-a]イソインドール-9(5H)-イル)フェノキシ)-N-プロピルエタンチオアミド(3489の化合物)、
 2-(4-(3-イソプロピル-2-(メトキシイミノ)-5-オキソ-1H-ピロロ[2, 1-a]イソインドール-9(3H, 5H)-イル)-2-メチルフェノキシ)-N-プロピルアセトアミド(3499の化合物)、
- 15 2-(4-(3-イソプロピル-1, 1-ジメチル-2, 5-ジオキソ-2, 3-ジヒドロ-1H-ピロロ[2, 1-a]イソインドール-9(5H)-イル)フェノキシ)-N-プロピルアセトアミド(3511の化合物)、
- 20 9b-(3-ヨード-4-メトキシフェニル)-3-イソプロピル[1, 3]チアゾロ[2, 3-a]イソインドール-2, 5(3H, 9bH)-ジオン(4063の化合物)、
 N-エチル-2-(2-ヨード-4-(3-イソプロピル-2, 5-ジオキソ-2, 3-ジヒドロ[1, 3]チアゾロ[2, 3-a]イソインドール-9(5H)-イル)フェノキシ)アセトアミド(4073の化合物)及び
 25 2-(2-ヨード-4-(3-イソプロピル-2, 5-ジオキソ-2, 3-ジヒドロ[1, 3]チアゾロ[2, 3-a]イソインドール-9(5H)-イル)フェノキシ)-N-プロピルアセトアミド(4074の化合物)等がさらに好適な化合物である。

次に、本発明の一般式 [I] の化合物の製造方法について説明する。

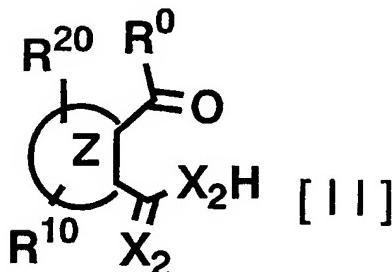
一般式 [I] の化合物は、以下の製造法A又は製造法Bで製造することができる。

製造法A

- 5 本製造法は、一般式 [I] の化合物のうち、Yが酸素原子又は基：NR⁵若しくは基：CR⁶R⁷（ここにおいて、R⁵、R⁶及びR⁷は、前記の意味を有する）である、本発明の一般式 [I-1] の化合物又は一般式 [I-2] の化合物若しくは一般式 [I-3] の化合物の製造法である。また、本発明の一般式 [I-1] の化合物又は一般式 [I-2] の化合物は、通常の液相における合成のみならず、
10 近年発達の目覚しい例えばコンビナトリアル合成法やパラレル合成法等の固相を用いた合成によっても製造することができる。

(第1工程)

一般式 [III]



- 15 [式中、R⁰は、アジド基、保護されていてもよいアミノ基、カルバモイル基、カルバモイルアミノ基、カルバモイルオキシ基、保護されていてもよいカルボキシル基、シアノ基、スルファモイル基、スルホ基、ニトロ基、ハロゲン原子、保護されていてもよいヒドロキシ基、ホルミル基、ホルミルアミノ基、環状の飽和C₃-C₉脂肪族基、環状の不飽和C₃-C₉脂肪族基、アラルキル基、N-アラルキルアミノ基、N、N-ジアラルキルアミノ基、アラルキルオキシ基、アラルキルカルボニル基、N-アラルキルカルバモイル基、アリール基、N-アリールアミノ基、N、N-ジアリールアミノ基、アリールオキシ基、アリールスルホニル基、アリールスルホニルオキシ基、N-アリールスルホニルアミノ基、N-アリールスルホニルアミノC₁-C₁₀アルキルアミノ基、N-アリールスルホニルアミ

- ノ C_1-C_{10} アルキルカルバモイル基、N-アリールスルホニルアミノ C_1-C_6 アルコキシカルボニル基、アリールスルファモイル基、アリールスルファモイルオキシ基、N-アリールスルファモイル C_1-C_{10} アルキルカルバモイル基、アリールスルファモイル C_1-C_6 アルコキシカルボニル基、N-アリールカルバモイル基、アロイル基、アロキシ基、N-(N-アロイルアミノ) C_1-C_{10} アルキルカルバモイル基、N-アロイルアミノ C_1-C_{10} アルコキシカルボニル基、 C_2-C_6 アルカノイル基、N- C_2-C_6 アルカノイルアミノ基、N, N-ジ- C_2-C_6 アルカノイルアミノ基、N- C_1-C_6 アルキルアミノ基、N, N-ジ- C_1-C_6 アルキルアミノ基、N- C_1-C_{10} アルキルカルバモイル基、N- C_1-C_{10} アルキルチオカルバモイル基、N, N-ジ- C_1-C_{10} アルキルカルバモイル基、N, N-ジ- C_1-C_{10} アルキルチオカルバモイル基、N- C_2-C_6 アルケニルカルバモイル基、保護されていてもよいN-アミノ C_1-C_{10} アルキルカルバモイル基、N- C_1-C_6 アルコキシ C_1-C_{10} アルキルカルバモイル基、N- C_1-C_6 アルコキシカルボニル C_1-C_{10} アルキルカルバモイル基、N- C_1-C_6 アルコキシカルボニルアミノ C_1-C_{10} アルキルカルバモイル基、N- C_1-C_6 アルコキシカルボニルアミノ C_1-C_6 アルコキシカルボニル基、 C_1-C_6 アルキルチオ基、N- C_1-C_6 アルキルスルファモイル基、N, N-ジ- C_1-C_6 アルキルスルファモイル基、 C_1-C_6 アルキルスルフィニル基、 C_1-C_6 アルキルスルホニル基、N- C_1-C_6 アルキルスルホニルアミノ基、 C_1-C_6 アルコキシ基、 C_1-C_6 アルコキシカルボニル基、保護されていてもよいアミノ C_1-C_6 アルコキシカルボニル基、N- C_3-C_6 シクロアルキルアミノ基、 C_3-C_6 シクロアルキルオキシ基、N- C_3-C_6 シクロアルキルカルバモイル基及びN, N-ジ- C_3-C_6 シクロアルキルカルバモイル基からなる群より選択される置換基、イソオキサゾリル基、イソチアゾリル基、イミダゾリル基、オキサゾリル基、オキサジアゾリル基、チアゾリル基、チアジアゾリル基、チエニル基、トリアジニル基、トリアゾリル基、ピリジル基、ピラジニル基、ピリミジニル基、ピリダジニル基、ピラゾリル基、ピロリル基、ピラニル基、フリル基、フラザニル基、イミダゾリジニル基、イミダゾリニル基、テトラヒドロフラニル

基、ピラゾリジニル基、ピラゾリニル基、ピペラジニル基、ピペリジニル基、ピロリジニル基、ピロリニル基及びモルホリノ基からなる群より選択される5又は6員のヘテロ環基、アクリジニル基、イソキノリル基、イソインドリル基、インダゾリル基、インドリル基、インドリジニル基、エチレンジオキシフェニル基、

5 カルバゾリル基、キナゾリニル基、キノキサリニル基、キノリジニル基、キノリル基、クマロニル基、クロメニル基、フェナンスリジニル基、フェナンスロリニル基、ジベンゾフラニル基、ジベンゾチオフェニル基、シンノリニル基、チオナフテニル基、ナフチリジニル基、フェナジニル基、フェナキサジニル基、フェノチアジニル基、フタラジニル基、ブテリジニル基、ブリニル基、ベンゾイミダゾリル基、ベンゾオキサゾリル基、ベンゾチアゾリル基、ベンゾトリアゾリル基、ベンゾフラニル基及びメチレンジオキシフェニル基からなる群より選択される窒素原子、酸素原子及び硫黄原子からなる群より選ばれるヘテロ原子を1環系当たり1ないし5個有する1ないし3環性の複素芳香環基並びに該ヘテロ環基又は該複素芳香環基が置換した、 $N-C_1-C_{10}$ アルキルカルバモイル基、 $N-C_1-C_{10}$ アルキルチオカルバモイル基、チオカルボニル基並びにカルボニル基からなる群から選択される置換基並びに該置換基で置換されていてもよい、直鎖の飽和 C_1-C_9 脂肪族基、直鎖の不飽和 C_1-C_9 脂肪族基、分枝鎖の飽和 C_1-C_9 脂肪族基、分枝鎖の不飽和の C_1-C_9 脂肪族基、 C_1-C_6 アルコキシ基、 C_1-C_6 アルキルチオ基及び $N-C_1-C_6$ アルキルアミノ基からなる群より選択される置換

10 基からなる群より選択される置換基を1又はそれ以上有していてもよい、アリール基、アセナフチレニル基、アダマンチル基、アンスリル基、インデニル基、ノルボルニル基及びフェナンスリル基からなる群より選択される1ないし3環性の C_7-C_{15} 炭素芳香環基又はイソオキサゾリル基、イソチアゾリル基、イミダゾリル基、オキサゾリル基、オキサジアゾリル基、チアゾリル基、チアジアゾリル基、チエニル基、トリアジニル基、トリアゾリル基、ピリジル基、ピラジニル基、ピリミジニル基、ピリダジニル基、ピラゾリル基、ピロリル基、ピラニル基、フリル基、フラザニル基、イミダゾリジニル基、イミダゾリニル基、テトラヒドロフラニル基、ピラゾリジニル基、ピラゾリニル基、ピペラジニル基、ピペリジニル基、ピロリジニル基、ピロリニル基及びモルホリノ基からなる群より選択され

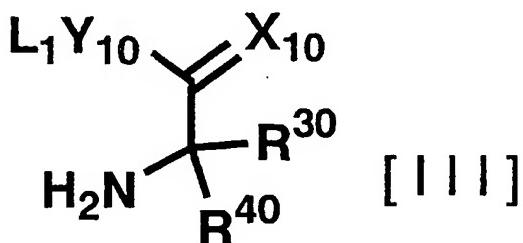
15

20

25

る5又は6員のヘテロ環基若しくはアクリジニル基、イソキノリル基、イソインドリル基、インダゾリル基、インドリル基、インドリジニル基、エチレンジオキシフェニル基、カルバゾリル基、キナゾリニル基、キノキサリニル基、キノリジニル基、キノリル基、クマロニル基、クロメニル基、フェナンスリジニル基、フェナンスロリニル基、ジベンゾフラニル基、ジベンゾチオフェニル基、シンノリニル基、チオナフテニル基、ナフチリジニル基、フェナジニル基、フェナキサジニル基、フェノチアジニル基、フタラジニル基、ブテリジニル基、ブリニル基、ベンゾイミダゾリル基、ベンゾオキサゾリル基、ベンゾチアゾリル基、ベンゾトリアゾリル基、ベンゾフラニル基及びメチレンジオキシフェニル基からなる群より
 5 選択される窒素原子、酸素原子及び硫黄原子からなる群より選ばれるヘテロ原子を1環系当たり1ないし5個有する1ないし3環性の複素芳香環基、R¹⁰及びR²⁰は、同一又は異なって、水素原子、アジド基、保護されていてもよいアミノ基、カルバモイル基、カルバモイルアミノ基、カルバモイルオキシ基、保護されていてもよいカルボキシル基、シアノ基、スルファモイル基、スルホ基、ニトロ基、
 10 ハロゲン原子、保護されていてもよいヒドロキシ基、ホルミル基、ホルミルアミノ基、環状の飽和C₃—C₉脂肪族基、環状の不飽和C₃—C₉脂肪族基、アラルキル基、N—アラルキルアミノ基、アラルキルオキシ基、アラルキルカルボニル基、アリール基、N—アリールアミノ基、アリールオキシ基、アリールスルホニル基、N—アリールスルホニルアミノ基、N—アリールスルホニルアミノC₁—C₁₀ア
 15 ルキルアミノ基、N—アリールスルホニルアミノC₁—C₁₀アルキルカルバモイル基、N—アリールスルホニルアミノC₁—C₆アルコキシカルボニル基、C₂—C₆アルカノイル基、N—C₂—C₆アルカノイルアミノ基、アロイル基、N—アロイルアミノ基、N—アロイルC₁—C₁₀アルキルアミノ基、N—アロイルC₁—C₁₀アルキルカルバモイル基、N—C₁—C₆アルキルアミノ基、N、N—ジ—C
 20 C₁—C₆アルキルアミノ基、N—C₁—C₁₀アルキルカルバモイル基、N—C₁—C₁₀アルキルカルバモイル基、N—C₁—C₆アルキルスルファモイル基、C₁—C₆アルキルスルフィニル基、C₁—C₆アルキルスルホニル基、N—C₁—C₆アルキルスルホニルアミノ基、C₁—C₆アルキルチオ基、C₁—C₆アルコキシ基、C₁—C₆アルコキシカルボニル基、N—C₃—C₆シクロアルキルアミノ基、
 25

$C_3 - C_6$ シクロアルキルオキシ基及び $N - C_3 - C_6$ シクロアルキルカルバモイル基からなる群から選択される置換基又は該置換基で置換されていてもよい、直鎖の飽和 $C_1 - C_9$ 脂肪族基、直鎖の不飽和 $C_1 - C_9$ 脂肪族基、分枝鎖の飽和 $C_1 - C_9$ 脂肪族基、分枝鎖の不飽和の $C_1 - C_9$ 脂肪族基、 $N - C_1 - C_6$ アルキルアミノ基、 $C_1 - C_6$ アルキルチオ基若しくは $C_1 - C_6$ アルコキシ基を示し、 X_2 及び Z は、前記の意味を有する] で表されるカルボン酸又はチオカルボン酸と一般式 [III]



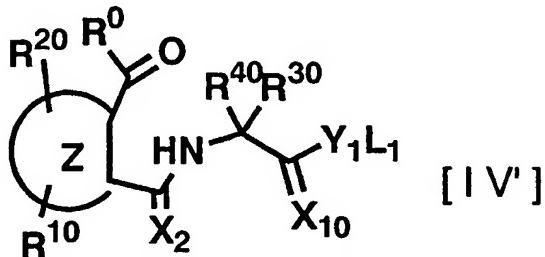
[式中、 Y_{10} は、酸素原子又は基 : NR^{50} 若しくは基 : $CR^{60}R^7$ (ここにおいて、 R^{50} は、水素原子、アミノ基の保護基、ハロゲン原子、保護されていてもよいヒドロキシ基、 $N - C_1 - C_6$ アルキルスルホニルアミノ基、 $C_1 - C_6$ アルコキシ基、 $C_1 - C_6$ アルコキシカルボニル基、 $C_2 - C_6$ アルカノイル基、カルバモイル基及び $N - C_1 - C_{10}$ アルキルカルバモイル基からなる群から選択される置換基又は該置換基で置換されていてもよい、直鎖の飽和 $C_1 - C_9$ 脂肪族基、直鎖の不飽和 $C_1 - C_9$ 脂肪族基、分枝鎖の飽和 $C_1 - C_9$ 脂肪族基若しくは分枝鎖の不飽和の $C_1 - C_9$ 脂肪族基、 R^{60} は、水素原子、ハロゲン原子、保護されていてもよいヒドロキシ基、 $N - C_1 - C_6$ アルキルスルホニルアミノ基、 $C_1 - C_6$ アルコキシ基、 $C_1 - C_6$ アルコキシカルボニル基、 $C_2 - C_6$ アルカノイル基、カルバモイル基及び $N - C_1 - C_{10}$ アルキルカルバモイル基からなる群から選択される置換基又は該置換基で置換されていてもよい、直鎖の飽和 $C_1 - C_9$ 脂肪族基、直鎖の不飽和 $C_1 - C_9$ 脂肪族基、分枝鎖の飽和 $C_1 - C_9$ 脂肪族基若しくは分枝鎖の不飽和の $C_1 - C_9$ 脂肪族基を示し、 R^7 は、前記の意味を有する)、 R^{30} 及び R^{40} は、同一又は異なって、水素原子、アジド基、アミジノ基、保護されていてもよいアミノ基、カルバモイル基、カルバモイルアミノ基、カルバモイルオキシ基、保護されていてもよいカルボキシル基、グアニジノ基、シアノ基、スルファモイル基、

スルホ基、ニトロ基、ハロゲン原子、保護されていてもよいヒドロキシ基、ホルミル基、ホルミルアミノ基、環状の飽和C₃—C₉脂肪族基、環状の不飽和C₃—C₉脂肪族基、C₂—C₆アルカノイル基、N—C₂—C₆アルカノイルアミノ基、N—C₁—C₆アルキルアミノ基、N, N-ジ-C₁—C₆アルキルアミノ基、N—C₁—C₁₀アルキルカルバモイル基、N, N-ジ-C₁—C₁₀アルキルカルバモイル基、C₁—C₆アルキルチオ基、N—C₁—C₆アルキルスルファモイル基、C₁—C₆アルキルスルフィニル基、C₁—C₆アルキルスルホニル基、N—C₁—C₆アルキルスルホニルアミノ基、C₁—C₆アルコキシ基、C₁—C₆アルコキシカルボニル基、N—C₃—C₆シクロアルキルアミノ基、C₃—C₆シクロアルキルオキシ基及びN—C₃—C₆シクロアルキルカルバモイル基からなる群から選択される置換基、該置換基で置換されていてもよい、直鎖の飽和C₁—C₉脂肪族基、直鎖の不飽和C₁—C₉脂肪族基、分枝鎖の飽和C₁—C₉脂肪族基及び分枝鎖の不飽和のC₁—C₉脂肪族基からなる群から選択される置換基、アジド基、保護されていてもよいアミノ基、カルバモイル基、カルバモイルアミノ基、カルバモイルオキシ基、保護されていてもよいカルボキシル基、シアノ基、スルファモイル基、スルホ基、ニトロ基、ハロゲン原子、保護されていてもよいヒドロキシ基、ホルミル基、ホルミルアミノ基、環状の飽和C₃—C₉脂肪族基、環状の不飽和C₃—C₉脂肪族基、アラルキル基、N—アラルキルアミノ基、N, N-ジアラルキルアミノ基、アラルキルオキシ基、アラルキルカルボニル基、N—アラルキルカルバモイル基、アリール基、N—アリールアミノ基、N, N-ジアリールアミノ基、アリールオキシ基、アリールスルホニル基、アリールスルホニルオキシ基、N—アリールスルホニルアミノ基、N—アリールスルホニルアミノC₁—C₁₀アルキルアミノ基、N—アリールスルホニルアミノC₁—C₆アルコキシカルボニル基、アリールスルファモイル基、アリールスルファモイルオキシ基、N—アリールスルファモイル基、アリールカルバモイル基、アリールカルバモイルC₁—C₆アルコキシカルボニル基、N—アリールカルバモイル基、アロイル基、アロキシ基、N—(N—アロイルアミノ)C₁—C₁₀アルキルカルバモイル基、N—アロイルアミノC₁—C₁₀アルコキシカルボニル基、C₂—C₆アルカノイル基、N—C₂—C₆

アルカノイルアミノ基、N, N-ジ-C₂-C₆アルカノイルアミノ基、N-C₁-C₆アルキルアミノ基、N, N-ジ-C₁-C₆アルキルアミノ基、N-C₁-C₁₀アルキルカルバモイル基、N-C₁-C₁₀アルキルチオカルバモイル基、N, N-ジ-C₁-C₁₀アルキルカルバモイル基、N, N-ジ-C₁-C₁₀アルキルチオカルバモイル基、N-C₂-C₆アルケニルカルバモイル基、N, N-ジ-C₂-C₆アルケニルカルバモイル基、保護されていてもよいN-アミノC₁-C₁₀アルキルカルバモイル基、N-C₁-C₆アルコキシC₁-C₁₀アルキルカルバモイル基、N-C₁-C₆アルコキシカルボニルC₁-C₁₀アルキルカルバモイル基、N-C₁-C₆アルコキシカルボニルアミノC₁-C₁₀アルキルカルバモイル基、N-C₁-C₆アルコキシカルボニル基、C₁-C₆アルキルチオ基、N-C₁-C₆アルキルスルファモイル基、N, N-ジ-C₁-C₆アルキルスルファモイル基、C₁-C₆アルキルスルホニル基、N-C₁-C₆アルキルスルホニルアミノ基、C₁-C₆アルコキシ基、C₁-C₆アルコキシカルボニル基、保護されていてもよいアミノC₁-C₆アルコキシカルボニル基、N-C₃-C₆シクロアルキルアミノ基、N, N-ジ-C₃-C₆シクロアルキルアミノ基、C₃-C₆シクロアルキルオキシ基、N-C₃-C₆シクロアルキルカルバモイル基及びN, N-ジ-C₃-C₆シクロアルキルカルバモイル基からなる群より選択される置換基、イソオキサゾリル基、イソチアゾリル基、イミダゾリル基、オキサゾリル基、オキサジアゾリル基、チアゾリル基、チアジアゾリル基、チエニル基、トリアジニル基、トリアゾリル基、ピリジル基、ピラジニル基、ピリミジニル基、ピリダジニル基、ピラゾリル基、ピロリル基、ピラニル基、フリル基、フラザニル基、イミダゾリジニル基、イミダゾリニル基、テトラヒドロフラニル基、ピラゾリジニル基、ピラゾリニル基、ピペラジニル基、ピペリジニル基、ピロリジニル基、ピロリニル基及びモルホリノ基からなる群より選択される5又は6員のヘテロ環基、アクリジニル基、イソキノリル基、イソインドリル基、インダゾリル基、インドリル基、インドリジニル基、エチレンジオキシフェニル基、カルバゾリル基、キナゾリニル基、キノキサリニル基、キノリジニル基、キノリル基、クマロニル基、クロメニル基、フェナヌスリジニル基、フェナンスロリニル基、ジベンゾフラニル基、ジベンゾチオフェ

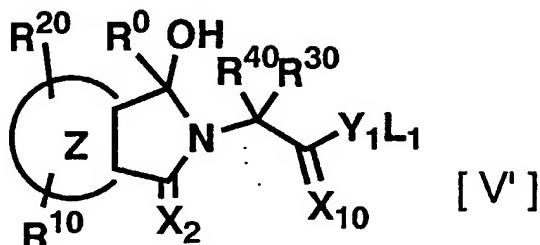
ニル基、シンノリニル基、チオナフテニル基、ナフチリジニル基、フェナジニル基、フェナキサジニル基、フェノチアジニル基、フタラジニル基、ブテリジニル基、ブリニル基、ベンゾイミダゾリル基、ベンゾオキサゾリル基、ベンゾチアゾリル基、ベンゾトリアゾリル基、ベンゾフラニル基及びメチレンジオキシフェニル基からなる群より選択される窒素原子、酸素原子及び硫黄原子からなる群より選ばれるヘテロ原子を1環系当たり1ないし5個有する1ないし3環性の複素芳香環基並びに該ヘテロ環基又は該複素芳香環基が置換した、N—C₁—C₁₀アルキルカルバモイル基、N—C₁—C₁₀アルキルチオカルバモイル基、チオカルボニル基並びにカルボニル基からなる群から選択される置換基並びに該置換基で置換されていてもよい、直鎖の飽和C₁—C₉脂肪族基、直鎖の不飽和C₁—C₉脂肪族基、分枝鎖の飽和C₁—C₉脂肪族基、分枝鎖の不飽和のC₁—C₉脂肪族基、C₁—C₆アルコキシ基、C₁—C₆アルキルチオ基及びN—C₁—C₆アルキルアミノ基からなる群より選択される置換基からなる群より選択される置換基を1又はそれ以上有していてもよい、アリール基、アセナフチレニル基、アダマンチル基、15 アンスリル基、インデニル基、ノルボルニル基及びフェナンスリル基からなる群より選択される1ないし3環性のC₇—C₁₅炭素芳香環基又はイソオキサゾリル基、イソチアゾリル基、イミダゾリル基、オキサゾリル基、オキサジアゾリル基、チアゾリル基、チアジアゾリル基、チエニル基、トリアジニル基、トリアゾリル基、ピリジル基、ピラジニル基、ピリミジニル基、ピリダジニル基、ピラゾリル基、ピロリル基、ピラニル基、フリル基、フラザニル基、イミダゾリジニル基、イミダゾリニル基、テトラヒドロフラニル基、ピラゾリジニル基、ピラゾリニル基、ピペラジニル基、ピペリジニル基、ピロリジニル基、ピロリニル基及びモルホリノ基からなる群より選択される5又は6員のヘテロ環基若しくはアクリジニル基、イソキノリル基、イソインドリル基、インダゾリル基、インドリル基、イ20 ンドリジニル基、エチレンジオキシフェニル基、カルバゾリル基、キナゾリニル基、キノキサリニル基、キノリジニル基、キノリル基、クマロニル基、クロメニル基、フェナンスリジニル基、フェナンスロリニル基、ジベンゾフラニル基、ジベンゾチオフェニル基、シンノリニル基、チオナフテニル基、ナフチリジニル基、フェナジニル基、フェナキサジニル基、フェノチアジニル基、フタラジニル基、

- 2 プテリジニル基、プリニル基、ベンゾイミダゾリル基、ベンゾオキサゾリル基、
 ベンゾチアゾリル基、ベンゾトリアゾリル基、ベンゾフラニル基及びメチレンジ
 オキシフェニル基からなる群より選択される窒素原子、酸素原子及び硫黄原子か
 らなる群より選ばれるヘテロ原子を1環系当たり1ないし5個有する1ないし3
- 5 環性の複素芳香環基又は該アリール基、該炭素芳香環基、該ヘテロ環基若しくは
 該複素芳香環基で置換されていてもよい、直鎖の飽和C₁—C₉脂肪族基、直鎖の
 不飽和C₁—C₉脂肪族基、分枝鎖の飽和C₁—C₉脂肪族基若しくは分枝鎖の不飽
 和のC₁—C₉脂肪族基を示すか、又はR³⁰及びR⁴⁰は、一緒になって、直鎖の飽
 和C₁—C₉脂肪族基、直鎖の不飽和C₁—C₉脂肪族基、分枝鎖の飽和C₁—C₉
- 10 脂肪族基若しくは分枝鎖の不飽和のC₁—C₉脂肪族基又は5若しくは6員の飽
 和炭素環基若しくは5若しくは6員の不飽和の炭素環を形成し、L₁は、水素原
 子、カルボキシル基の保護基若しくはアミノ基の保護基又はペプチドの固相合成
 におけるカルボキシル基若しくはアミノ基の樹脂担体、X₁₀は、酸素原子、硫黄
 原子又は基：NR⁵⁰（ここにおいて、R⁵⁰は前記の意味を有する）を示す]で表
 15 されるアミン誘導体とを反応させ、次いでアミノ基の保護基、ヒドロキシ基の保
 護基又はカルボキシル基の保護基〔具体的には、Y₁₀（すなわちR⁵⁰）又はL₁
 が、アミノ基の保護基、ヒドロキシ基の保護基又はカルボキシル基の保護基を有
 する場合は当該保護基〕を適宜除去する（L₁がアミノ基の保護基の場合は、R⁵
 0が直鎖若しくは分枝鎖の飽和若しくは不飽和のC₁—C₉脂肪族基の場合に限
 20 る。）ことにより、一般式〔IV'〕



[式中、Y₁は、酸素原子又は基：NR⁵若しくは基：CR⁶R⁷（ここにおいて、
 R⁵、R⁶及びR⁷は、前記の意味を有する）を示し、R⁰、R¹⁰、R²⁰、R³⁰、
 R⁴⁰、L₁、X₂、X₁₀及びZは前記の意味を有する]で表される化合物に変換す
 25 る。

なお、一般式 [IV'] で表される化合物は、溶媒中において、一般式 [V']



- [式中、R⁰、R¹⁰、R²⁰、R³⁰、R⁴⁰、L₁、X₂、X₁₀、Y₁及びZは、前記の意味を有する] で表される化合物との平衡状態にある。一般式 [IV'] の化合物と一般式 [V'] の化合物は、本発明の一般式 [I] の化合物の製造中間体として有用であり、反応に用いる際には、通常平衡混合物として用いる。

- また、ペプチドの固相合成におけるカルボキシリ基又はアミノ基の樹脂担体としては、具体的には例えばポリエチレンジビニルベンゼン共重合体、ポリスチレンジビニルベンゼン共重合体等が挙げられる。またこれらの重合体にポリエチレングリコールを挟んだ樹脂を使用することもでき、中でもカルボキシリ基の樹脂担体としては、p-ベンジルオキシベンジルアルコール樹脂[WangTM Resin] が好適であり、アミノ基の樹脂担体としては、トリチルクロリド樹脂[Triptyl Chloride Resin] が好適である。

- 反応で使用する試薬は、原料化合物及び反応条件によって適宜増減することができるが、通常、反応は、脱水した不活性有機溶媒中、一般式 [II] のカルボン酸又はチオカルボン酸と一般式 [III] のアミン誘導体とを、適宜塩基、縮合補助剤及び／又は縮合剤の存在下に、-100℃から溶媒の沸点温度、好ましくは0~30℃、0.5~96時間、好ましくは3~24時間反応させることができる。次いで縮合化合物がアミノ基の保護基、ヒドロキシ基の保護基又はカルボキシリ基の保護基を有する場合は、適宜当該保護基を除去することにより、反応は完結する。

- 反応で使用される不活性有機溶媒としては、反応に悪影響を及ぼさないものであれば、特に限定されないが、具体的には例えば塩化メチレン、クロロホルム、1,2-ジクロロエタン、トリクロロエタン、N,N-ジメチルホルムアミド、酢酸エチルエステル、酢酸メチルエステル、アセトニトリル、無水酢酸、メチル

アルコール、エチルアルコール、ベンゼン、キシレン、水、酢酸、トルエン、1, 4-ジオキサン、テトラヒドロフラン等が挙げられるが、好適な反応温度の確保の点から、特に例えば塩化メチレン、クロロホルム、1, 2-ジクロロエタン、アセトニトリル、N, N-ジメチルホルムアミド、1, 4-ジオキサン、トルエン等が好適である。

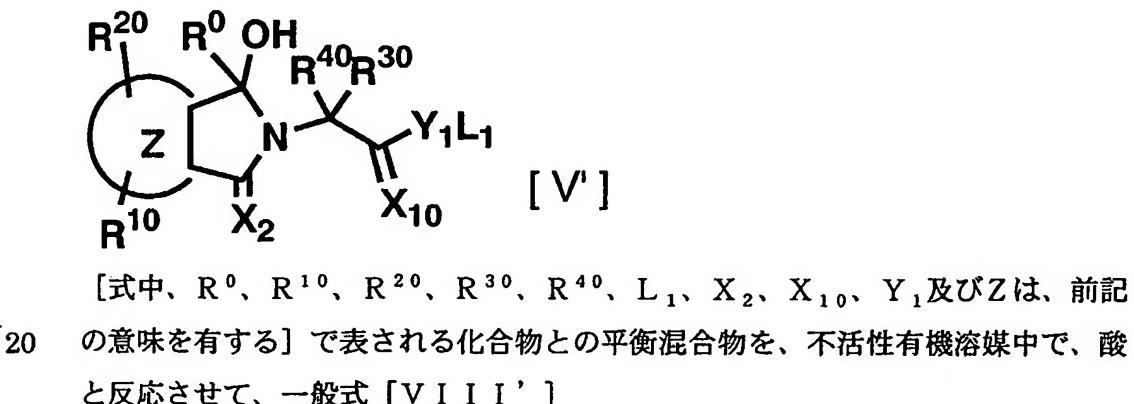
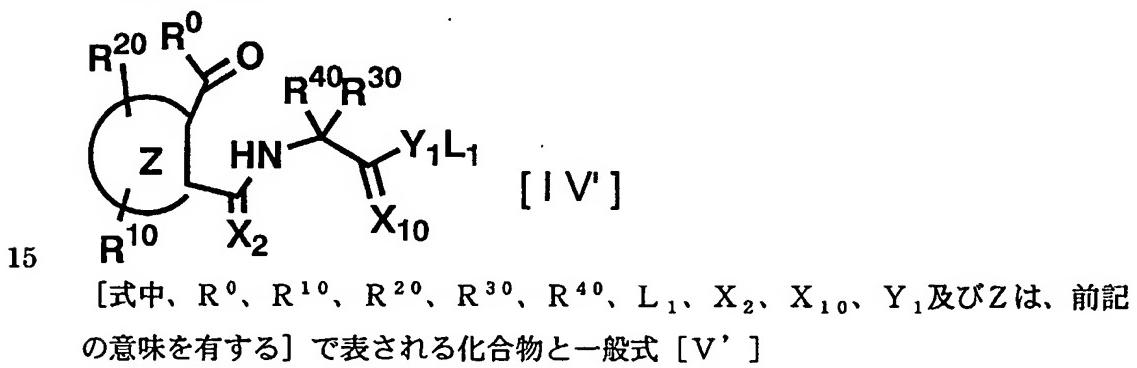
- 反応で使用される塩基としては、例えばトリメチルアミン、トリエチルアミン、N, N-ジイソプロピルエチルアミン、N-メチルモルホリン、N-メチルピロリジン、N-メチルピペリジン、N, N-ジメチルアニリン、1, 8-ジアザビシクロ[5. 4. 0]ウンデカ-7-エン(DBU)、1, 5-アザビシクロ[4. 10. 0]ノナ-5-エン(DBN)等の第3級脂肪族アミン；例えばピリジン、4-ジメチルアミノピリジン、ピコリン、ルチジン、キノリン、イソキノリン等の芳香族アミン；例えば金属カリウム、金属ナトリウム、金属リチウム等のアルカリ金属；例えば水素化ナトリウム、水素化カリウム等のアルカリ金属水素化物；例えばブチルリチウム等のアルカリ金属アルキル化物；例えばカリウム-tert-ブチラート、ナトリウムエチラート、ナトリウムメチラート等のアルカリ金属アルコキシド；例えば水酸化カリウム、水酸化ナトリウム等のアルカリ金属水酸化物；例えば炭酸カリウム等のアルカリ金属炭酸塩等が挙げられ、中でも例えば第3級脂肪族アミン等が好ましく、特に例えばトリエチルアミン、N, N-ジイソプロピルエチルアミン等が好適である。
- 反応で使用される縮合補助剤としては、例えばN-ヒドロキシベンゾトリアゾール水和物、N-ヒドロキシスクシンイミド、N-ヒドロキシ-5-ノルボルネン-2, 3-ジカルボキシイミド、3-ヒドロキシ-3, 4-ジヒドロ-4-オキソ-1, 2, 3-ベンゾトリアゾール等が挙げられ、中でも例えばN-ヒドロキシベンゾトリアゾール等が好適である。
- 反応で使用される縮合剤としては、例えば塩化チオニル、N, N-ジシクロヘキシリカルボジイミド、1-メチル-2-プロモピリジニウムアイオダイド、N, N'-カルボニルジイミダゾール、ジフェニルフォスフォリルクロリド、ジフェニルフォスフォリルアジド、N, N'-ジスクシニミジルカルボネート、N, N'-ジスクシニミジルオキザレート、1-エチル-3-(3-ジメチルアミノ)プロピ

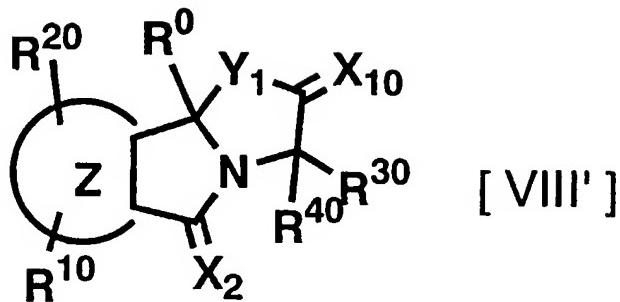
ル) カルボジイミド塩酸塩、クロロギ酸エチル、クロロギ酸イソブチル、ベンゾトリアゾー-1-リルーオキシトリス(ジメチルアミノ)フォスフォニウムヘキサフルオロフェイト等が挙げられ、中でも例えばN,N-ジシクロヘキシリカルボジイミド、1-エチル-3-(3-ジメチルアミノプロピル)カルボジイミド塩酸塩、クロロギ酸エチル、クロロギ酸イソブチル等が好適である。

反応において使用する試薬は、原料化合物及び反応条件によって、適宜増減することができるが、通常一般式【II】のカルボン酸又はチオカルボン酸に対して0.02~50等量、好ましくは0.2~2等量の一般式【III】のアミン誘導体、1~50等量、好ましくは3~5等量の塩基、1~50等量、好ましくは1~5等量の縮合補助剤及び/又は1~50等量、好ましくは1~5等量の縮合剤を使用する。該塩基、該縮合補助剤及び該縮合剤は、一種又はそれ以上適宜組み合わせて使用することができる。

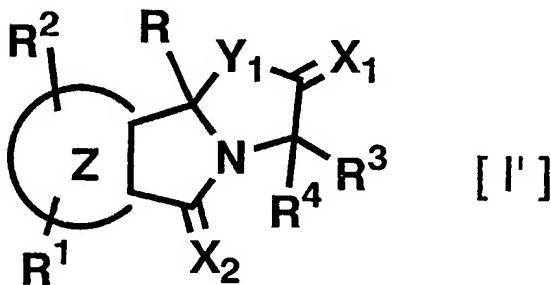
(第2工程)

次に、一般式【IV'】





[式中、R⁰、R¹⁰、R²⁰、R³⁰、R⁴⁰、X₂、X₁₀、Y₁及びZは、前記の意味を有する]で表される化合物とし、次いで適宜存在する保護基を除去することにより、一般式[I']



5 [式中、R、R¹、R²、R³、R⁴、X₁、X₂、Y₁及びZは、前記の意味を有する]で表される化合物、即ち、一般式[I-1]の化合物又は一般式[I-2]の化合物若しくは一般式[I-3]の化合物又はその医薬上許容される塩を製造することができる。また、L₁がペプチドの固相合成におけるカルボキシル基又
10 はアミノ基の樹脂担体である場合、該酸との反応において、当該樹脂担体を除去することにより、一般式[I-1]の化合物又は一般式[I-2]の化合物を製造することができる。さらには、一般式[I']の化合物において、X₁がNR⁵
（ここにおいて、R⁵は前記の意味を有する）の化合物又はY₁がNR⁵若しくは
基：CR⁶R⁷（ここにおいて、R⁵、R⁶及びR⁷は前記の意味を有する）の化合
15 物は、これらの置換基を有する原料化合物を使用して通常製造することができる
が、X₁₀が酸素原子若しくはNHの化合物又はY₁がNH若しくは基：CHR⁷
（ここにおいて、R⁷は前記の意味を有する）の化合物である一般式[VIII']
の化合物を製造し、次いで酸素原子を常法によりNR⁵（R⁵は、前記の意味を有
する）に置換すること又はNH若しくは基：CHR⁷（ここにおいて、R⁷は前記

の意味を有する) に R⁵若しくは R⁶ (R⁵及びR⁶は、前記の意味を有する) を常法により導入することにより、所望の一般式 [I'] の化合物を製造することも可能である。上記の導入方法としては、例えばカルボニル基をメトキシリアルミニ
5 塩酸塩と反応させてメトキシム基へと変換する反応、基: C H R⁷ (ここにおいて、R⁷は前記の意味を有する) をアルキル金属試薬と反応させ、次いでハロゲン化アルキルで処理することにより基: C R⁶ R⁷ (ここにおいて、R⁶及びR⁷は前記の意味を有する) が得られる反応等が挙げられる。

反応で使用する試薬は、原料化合物及び反応条件によって適宜増減することができるが、通常、反応は、脱水した不活性有機溶媒中、一般式 [IV] の化合物
10 と一般式 [V] の化合物との平衡混合物と触媒量の酸とを、-100℃から溶媒の沸点温度、好ましくは0~30℃、0.5~96時間、好ましくは2~24時間反応させることができる。次いでアミノ基の保護基が存在する場合は、適宜当該アミノ基の保護基を除去することにより、反応は完結する。

なお、L₁以外の他の官能基を保護する保護基は、保護基の種類、保護基の除去方法又は反応条件等を適宜選択することにより、例えばN-保護基、カルボキシル基の保護基、ヒドロキシ基の保護基等を同時に除去することもできる。又、
15 N-保護基、カルボキシリル基の保護基、又はヒドロキシ基の保護基のいずれか一方を選択的に除去することもでき、さらには該保護基の除去順序は、特に制限されるものではない。

20 ヒドロキシ基の保護基としては、例えばtert-ブチルジメチルシリル基、tert-ブチルジフェニルシリル基等の低級アルキルシリル基；例えばメトキシメチル基、2-メトキシエトキシメチル基等の低級アルコキシメチル基；例えばベンジル基、p-メトキシベンジル基等のアラルキル基；例えばホルミル基、アセチル基等のアシル基等が挙げられ、特にtert-ブチルジメチルシリル基、
25 アセチル基等が好ましい。

アミノ基の保護基としては、例えばベンジル基、p-ニトロベンジル基等のアラルキル基；例えばホルミル基、アセチル基等のアシル基；例えばエトキシカルボニル基、tert-ブトキシカルボニル基等の低級アルコキシカルボニル基；例えばベンジルオキシカルボニル基、p-ニトロベンジルオキシカルボニル基等

のアラルキルオキシカルボニル基等が挙げられ、特に p-ニトロベンジル基、tert-ブトキシカルボニル基、ベンジルオキシカルボニル基等が好ましい。

カルボキシリ基の保護基としては、例えばメチル基、エチル基、tert-ブチル基等の低級アルキル基；例えばベンジル基、p-メトキシベンジル基等のアラルキル基等が挙げられ、特にメチル基、エチル基、tert-ブチル基、ベンジル基等が好ましい。

- 保護基の除去はその種類及び化合物の安定性により異なるが、文献記載の方法 [プロテクティブ・グループ・イン・オーガニック・シンセシス (Protective Groups in Organic Synthesis), T. W. Greene (T. W. Greene) 著、John Wiley & Sons 社 (1981) 年参照] 又はそれに準ずる方法に従って、例えば酸又は塩基を用いる加溶媒分解、水素化金属錯体等を用いる化学的還元又はパラジウム炭素触媒、ラネーニッケル触媒等を用いる接触還元等により行うことができる。

- 反応で使用される不活性有機溶媒としては、反応に悪影響を及ぼさないものであれば、特に限定されないが、前記の不活性溶媒が挙げられる。

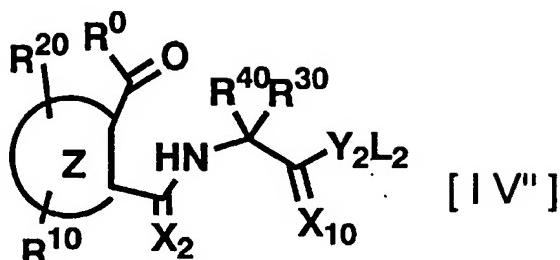
- 反応で使用される酸としては、例えば塩酸、硝酸、臭化水素酸、硫酸、フッ化水素酸、過塩素酸等の無機酸；例えばトリフルオロホウ酸等のルイス酸；例えば p-トルエンスルホン酸、トリフルオロメタンスルホン酸、メタンスルホン酸等のスルホン酸；蟻酸、トリフルオロ酢酸、酢酸等の有機酸等が挙げられ、特に例えばトリフルオロホウ酸等のルイス酸又は例えばトリフルオロ酢酸等の有機酸等が好適である。

- 反応終了後、さらに通常の公知の方法で、生成物を精製することにより、一般式 [I-1] の化合物又は一般式 [I-2] の化合物若しくは一般式 [I-3] の化合物を得ることができる。反応液から一般式 [I-1] の化合物、一般式 [I-2] の化合物若しくは一般式 [I-3] の化合物又はその塩の単離精製は、溶媒抽出、再結晶、クロマトグラフィー等公知の分離手段により行うことができる。

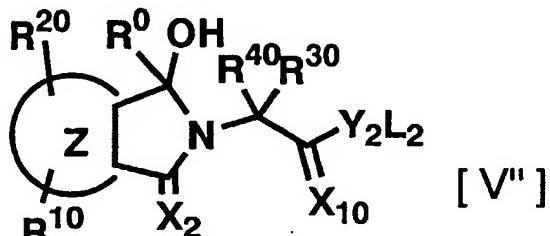
製造法B

本製造法は、一般式 [I] で表される化合物のうち、Yが硫黄原子である本発明の一般式 [I-4] の化合物の製造法である。

一般式 [IV'']

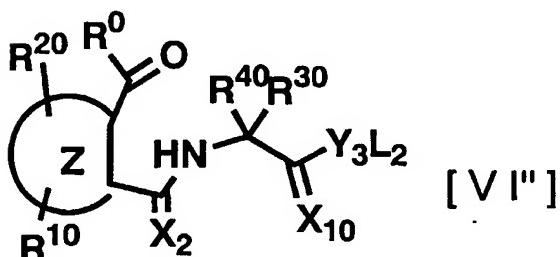


[式中、Y₂は、酸素原子、L₂は、水素原子を示し、R⁰、R¹⁰、R²⁰、R³⁰、R⁴⁰、X₂、X₁₀及びZは、前記の意味を有する]で表される化合物と一般式[V'']

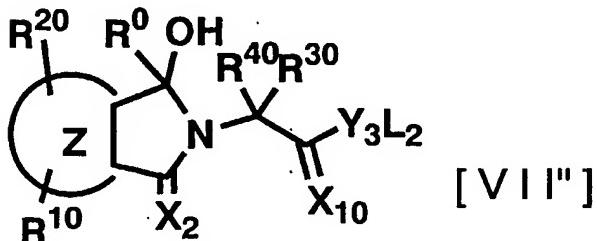


5

[式中、R⁰、R¹⁰、R²⁰、R³⁰、R⁴⁰、L₂、X₂、X₁₀、Y₂及びZは、前記の意味を有する]で表される化合物との平衡混合物と硫化剤とを反応させ、一般式 [VI'']

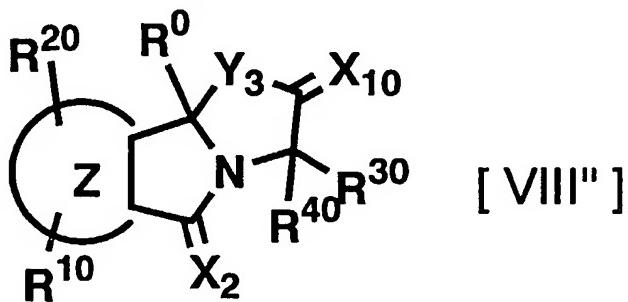


10 [式中、Y₃は硫黄原子を示し、R⁰、R¹⁰、R²⁰、R³⁰、R⁴⁰、L₂、X₂、X₁₀及びZは、前記の意味を有する]で表される化合物と一般式 [VII'']

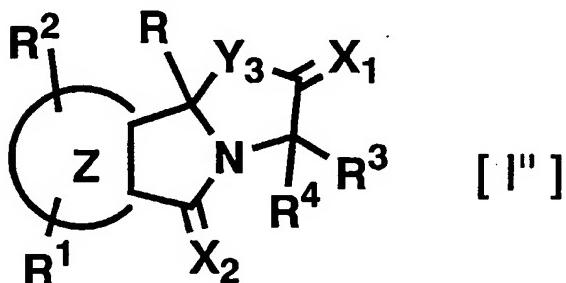


[式中、R⁰、R¹⁰、R²⁰、R³⁰、R⁴⁰、L₂、X₂、X₁₀、Y₃及びZは、前記

の意味を有する]で表される化合物との平衡混合物に変換し、引き続き、不活性有機溶媒中で、室温から溶媒の沸点温度において、酸と反応させて、一般式[V III I'']

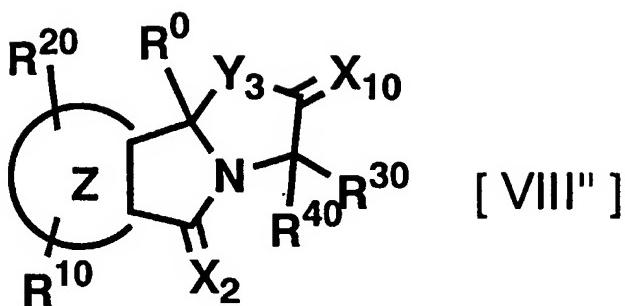


- 5 [式中、R⁰、R¹⁰、R²⁰、R³⁰、R⁴⁰、X₂、X₁₀、Y₃及びZは、前記の意味を有する]で表される化合物とし、適宜保護基を除去することにより、一般式[I'']

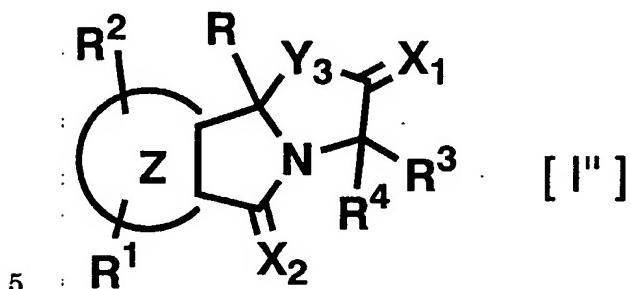


- 10 [式中、R、R¹、R²、R³、R⁴、X₁、X₂、Y₃及びZは、前記の意味を有する]で表される化合物又はその医薬上許容される塩を製造することができる。

反応で使用する試薬は、原料化合物及び反応条件によって適宜増減することができるが、通常、反応は、脱水した不活性有機溶媒中、一般式[I V'']の化合物と一般式[V'']の化合物との平衡混合物と硫化剤とを、-100℃から溶媒の沸点温度、好ましくは0~30℃、0.5~96時間、好ましくは1~1.2時間反応させて、一般式[V I'']の化合物と一般式[V II'']の化合物との平衡混合物に変換し、次いで製造法Aの第2工程と同様の方法で反応を行い、一般式[V III I'']



[式中、R⁰、R¹⁰、R²⁰、R³⁰、R⁴⁰、X₂、X₁₀、Y₃及びZは、前記の意味を有する]で表される化合物とし、次いで適宜存在する保護基を除去した後、適當な方法で精製することにより、一般式 [I'']



5 [式中、R、R¹、R²、R³、R⁴、X₁、X₂、Y₃及びZは、前記の意味を有する]で表される化合物、即ち一般式 [I-4] の化合物を製造することができる。反応液から一般式 [I-4] の化合物又はその塩の単離精製は、製造法Aと同様に溶媒抽出、再結晶、クロマトグラフィー等公知の分離手段により行うことができる。

10

なお、一般式 [I I] のカルボン酸又はチオカルボン酸は、文献公知であるか、又は一般式 [IX]



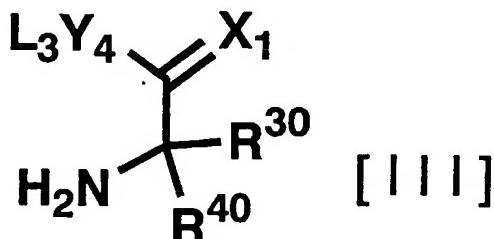
15 [式中、Xは、ハロゲン原子を示し、R⁰は、前記の意味を有する]で表されるハロゲン化アリール化合物と金属マグネシウムとを、例えばジエチルエーテル、テトラヒドロフラン等適當なエーテル系脱水溶媒中、低温から溶媒の沸点温度で反応させることにより調製されるグリニアル試薬と、置換されていてもよい酸無水物とを、前記の脱水した不活性有機溶媒中、低温から室温で反応させることにより製造することができる。

また、一般式 [II] の化合物は、一般式 [X]

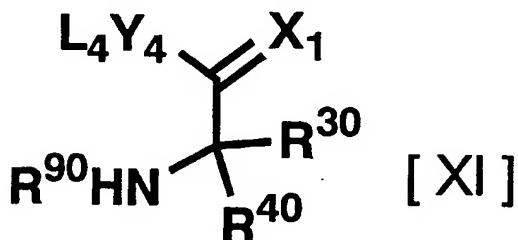


- [式中、 R^0 は前記の意味を有する] のアレン化合物と、置換又は非置換の酸無水物とを、適宜前記の酸の存在下、フリーデルークラフトーアシル化反応を行うことによっても製造することができる。

なお、一般式 [III] の化合物は、文献公知であるか、一般式 [III]



- [式中、 Y_4 は、酸素原子、 L_3 は、水素原子若しくはカルボキシリ基の保護基又はペプチドの固相合成におけるカルボキシリ基の樹脂担体、 R^{30} 、 R^{40} 及び X_1 は前記の意味を有する] で表されるアミノ酸若しくはアミノ酸より導くことの可能なアミノ酸誘導体であるか又は一般式 [XI]



- [式中、 L_4 は、水素原子又はカルボキシリ基の保護基、 R^{90} は、水素原子又はアミノ基の保護基、 R^{30} 、 R^{40} 及び X_1 及び Y_4 は前記の意味を有する] で表されるアミノ酸又はアミノ酸より導くことのできるアミノ酸誘導体のカルボン酸若しくはチオカルボン酸と

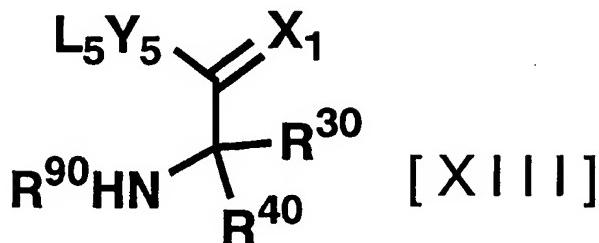
一般式 [XII]



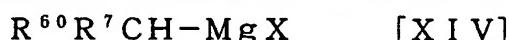
- [式中、 R^{80} はアミノ基の保護基又はペプチドの固相合成におけるアミノ基の樹脂担体を示し、 R^{50} は前記の意味を有する] で表されるアミン誘導体とを反応させ、次いで R^{90} がアミノ基の保護基の場合は当該アミノ基の保護基を除去するこ

とにより製造できる。

また、一般式 [I I I] の化合物は、一般式 [X I I I]



- [式中、 Y_5 は酸素原子又は窒素原子、 L_5 は、カルボキシル基の保護基又は水素原子若しくはアミノ基の保護基、 R^{30} 、 R^{40} 、 R^{90} 及び X_1 は前記の意味を有する]で表されるアミノ酸又はアミノ酸誘導体と一般式 [X I V]



- [式中、 X はハロゲン原子を示し、 R^{60} 及び R^7 は前記の意味を有する]で表されるグリニアル試薬とを反応させ、次いで R^{90} がアミノ基の保護基の場合は、当該アミノ基の保護基を除去することによっても製造できる。

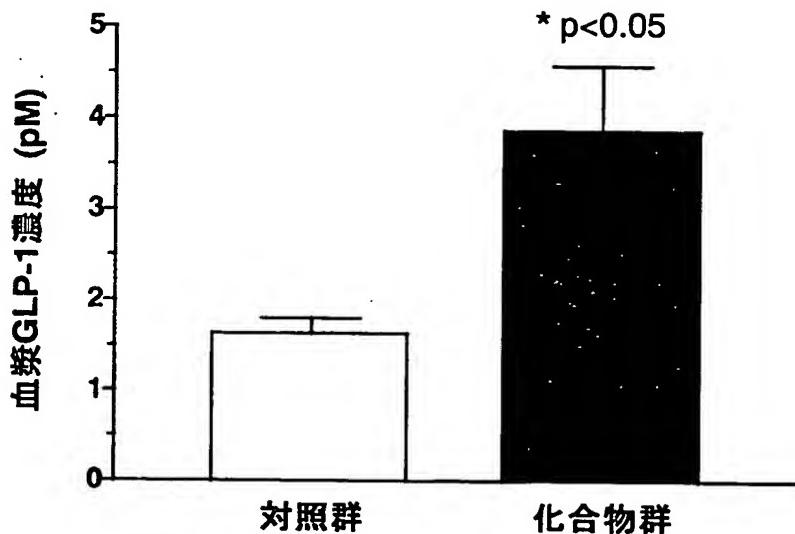
次に、本発明の有用性を具体的に示すため、実施例 1002 の化合物を代表化合物とし、該化合物投与後の血しょう中 GLP-1 濃度への影響を検討した。その試験方法及び結果を以下に示す。

(試験方法)

- 自由摂食、摂水条件で飼育した雄性ウイスター ラット（第 9 週令、 $n = 6$ ）を、試験前夜から絶食し、1%カルボキシメチルセルロース溶液に懸濁した化合物を投与した。なお、対照群としては、1%カルボキシメチルセルロース溶液をラットに経口投与した。被検薬剤投与 30 分後に採血を行い、得られた血液から遠心分離を行って血漿を分離した。血漿中の GLP-1 濃度は市販の抗 GLP-1 抗体(コスモバイオ(株))を用い、ラジオイムノアッセイ法で定量した。得られた数値は、Student T 検定を用いて解析を行い、その統計学的有意差を算出した。その結果を下記の表 46 に示す。

= 試験結果 =

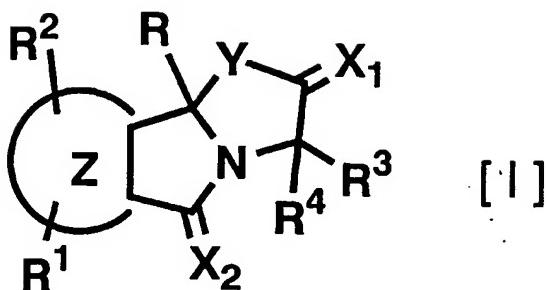
(表46)



以上の結果より、投与後30分に於いて、30mg/kgの化合物を投与された群の血漿では対照群と比較して有意に高値な血中GLP-1が認められた。この結果より、本発明の化合物はラットにおいて高い血中GLP-1濃度を呈することの出来る活性を持つことが示された。

本発明化合物は、高い血中GLP-1濃度を呈する活性を示していることから、糖尿病治療剤、糖尿病の慢性合併症の予防剤又は抗肥満薬として有用である。

本発明の一般式 [I] の化合物は、それを有効成分とする医薬、特に糖尿病治療剤、糖尿病の慢性合併症の予防剤又は抗肥満薬として使用することができるが、かかる医薬、特に糖尿病治療剤、糖尿病の慢性合併症の予防剤又は抗肥満薬における本発明の化合物は、医薬上許容される慣用的なものを意味し、例えば一般式 [I]



[式中、R、R¹、R²、R³、R⁴、X₁、X₂、Y及びZは、前記の意味を有する]で表される化合物、R、R¹、R²、R³又はR⁴上のカルボキシル基における医薬として許容されるエステル若しくは塩、R、R¹、R²、R³又はR⁴上の水酸基

5 在における塩又はR、R¹、R²、R³又はR⁴上のアミノ基における塩が含まれる。

該カルボキシル基又はヒドロキシ基における塩としては、例えばナトリウム塩、カリウム塩等のアルカリ金属塩；例えばカルシウム塩、マグネシウム塩等のアルカリ土類金属塩等が挙げられる。

該アミノ基における酸付加塩としては、例えば塩酸塩、硫酸塩、硝酸塩、りん
10 酸塩、炭酸塩、炭酸水素塩、過塩素酸塩等の無機酸塩；例えば酢酸塩、プロピオ
ン酸塩、乳酸塩、マレイン酸塩、フマル酸塩、酒石酸塩、りんご酸塩、くえん
酸塩、アスコルビン酸塩等の有機酸塩；例えばメタンスルホン酸塩、イセチオン
酸塩、ベンゼンスルホン酸塩、トルエンスルホン酸塩等のスルホン酸塩；例えば
アスパラギン酸塩、グルタミン酸塩等の酸性アミノ酸塩等が挙げられる。

15 本発明化合物は、糖尿病治療剤、糖尿病の慢性合併症の予防剤あるいは抗肥満
薬として使用される場合には、その薬学的に許容しうる塩としても使用するこ
ができる。薬学的に許容しうる塩の典型例としては、例えばナトリウム、カリウ
ム等のアルカリ金属との塩等を挙げることができる。

本発明の化合物の薬学的に許容しうる塩の製造法は、有機合成化学分野で通常
20 用いられる方法を適宜組み合わせて行うことができる。具体的には、本発明化合
物の遊離型の溶液をアルカリ溶液で中和滴定すること等が挙げられる。

本発明化合物を糖尿病治療剤、糖尿病の慢性合併症の予防剤あるいは抗肥満薬
として使用する際の投与形態としては各種の形態を選択でき、例えば錠剤、カプ
セル剤、散剤、顆粒剤、液剤等の経口剤、例えば溶液、懸濁液等の殺菌した液状

の非経口剤等が挙げられる。

- 固体の製剤は、そのまま錠剤、カプセル剤、顆粒剤又は粉末の形態として製造することもできるが、適当な添加物を使用して製造することもできる。該添加物としては、例えば乳糖、ブドウ糖等の糖類、例えばトウモロコシ、小麦、米等の澱粉類、例えばステアリン酸等の脂肪酸、例えばメタケイ酸ナトリウム、アルミニ酸マグネシウム、無水リン酸カルシウム等の無機塩、例えばポリビニルピロリドン、ポリアルキレングリコール等の合成高分子、例えばステアリン酸カルシウム、ステアリン酸マグネシウム等の脂肪酸塩、例えばステアリルアルコール、ベンジルアルコール等のアルコール類、例えばメチルセルロース、カルボキシメチルセルロース、エチルセルロース、ヒドロキシプロピルメチルセルロース等の合成セルロース誘導体、その他、水、ゼラチン、タルク、植物油、アラビアゴム等通常用いられる添加物等が挙げられる。

- これらの錠剤、カプセル剤、顆粒剤、粉末等の固形製剤は、一般的には0.1～100重量%、好ましくは5～100重量%の有効成分を含むことができる。
- 液状製剤は、水、アルコール類又は例えば大豆油、ピーナツ油、ゴマ油等の植物由来の油等液状製剤において通常用いられる適当な添加物を使用し、懸濁液、シロップ剤、注射剤等の形態として製造することができる。特に、非経口的に投与する場合の適当な溶剤としては、例えば注射用蒸留水、塩酸リドカイン水溶液(筋肉内注射用)、生理食塩水、ブドウ糖水溶液、エタノール、静脈内注射用液体(例えばクエン酸、クエン酸ナトリウム等の水溶液)、電解質溶液(例えば点滴静注、静脈内注射用)等又はこれらの混合溶液が挙げられる。

又、経口投与の懸濁剤又はシロップ剤等の液剤は、0.5～10重量%の有効成分を含むことができる。

- 本発明の化合物の実際に好ましい投与量は、使用される化合物の種類、配合された組成物の種類、適用頻度および治療すべき特定部位および患者の病状によって適宜増減することができる。例えば、一日当たりの成人一人当たりの投与量は、経口投与の場合、0.1ないし1000mgであり、非経口投与の場合、1日当たり0.01ないし500mgである。なお、投与回数は、投与方法および症状により異なるが、単回又は2ないし5回に分けて投与することができる。

発明を実施するための最良の形態

以下に、実施例を挙げて本発明を更に具体的に説明するが、本発明はこれらによって何ら限定されるものではない。

- 実施例の薄層クロマトグラフは、プレートとして Silicagel 60 F₂₄₅ (Merck) を、検出法としてUV検出器を用いた。カラム用シリカゲルとしては、Wakogel™ C-300 (和光純薬) を、逆相カラム用シリカゲルとしては、LC-SORB™ SP-B-ODS (Chemco) またはYM-C-GEL™ ODS-AQ 120-S50 (山村化学研究所) を用いた。
- i-Bu : イソブチル基
 10 n-Bu : n-ブチル基
 t-Bu : t-ブチル基
 Me : メチル基
 Et : エチル基
 Ph : フェニル基
 15 i-Pr : イソプロピル基
 n-Pr : n-プロピル基
 CDCl₃ : 重クロロホルム
 methanol-d₄ : 重メタノール
 DMSO-d₆ : 重ジメチルスルホキシド
 20 (実施例)

実施例 1001

- 9b-(2-メトキシフェニル)-3-(1-メチルエチル)[1,3]オキサゾロ[2,3-a]イソインドール-2,5(3H,9bH)-ジオン：(下記一般式[I-1]において、R¹:H; R²:H; R³:i-Pr; R⁴:H; Z: 25 Ph; R: 2-MeO-Phの化合物)

無水フタル酸 500 mg (3.4 mmol) を含むテトラヒドロフラン溶液 (1.2 ml) に、マグネシウム 120 mg (5.1 mmol) と 2-プロモアニソール 0.55 ml (4.4 mmol) とにより調製したグリニアル試薬のテトラヒドロフラン溶液 (1.7 ml) を、窒素雰囲気下、-70°Cにて10分間かけて滴

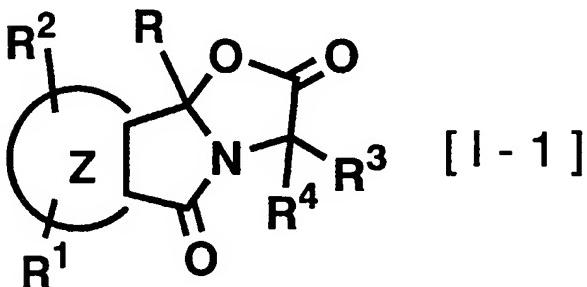
下した。反応溶液を-70℃で2.5時間攪拌後、反応溶液に飽和塩化アンモニウム水溶液を添加した。酢酸エチルエステルで反応溶液を抽出し、有機層を飽和食塩水溶液で洗浄後、乾燥し、減圧下に濃縮し、2-(2-メトキシベンゾイル)安息香酸の粗生成物770mg(収率:90%)を得た。

- 5 2-(2-メトキシベンゾイル)安息香酸750mg(3.0mmol)、D-バリンメチルエステル塩酸塩550mg(3.4mmol)及びトリエチルアミン1.26ml(9.1mmol)の塩化メチレン溶液(40ml)に、氷冷下、1-ヒドロキシベンゾトリアゾール水和物490mg(3.6mmol)と1-(3-ジメチルアミノプロピル)-3-エチルカルボジイミド塩酸塩690mg(3.6mmol)を加え、室温で反応溶液を3時間攪拌した。反応溶液に飽和塩化アンモニウム水溶液を添加し、クロロホルムで抽出し、有機層を飽和食塩水溶液で洗浄し、乾燥し、減圧下に濃縮した。得られた残渣をメタノール(15ml)に溶解し、4N水酸化ナトリウム水溶液(8ml)を加え、反応溶液を室温で12時間攪拌した後、減圧下に濃縮した。得られた残渣に1N塩酸水溶液(40ml)及び酢酸エチルエステルを加え、有機層を乾燥し、減圧下に濃縮した。得られた未精製のカルボン酸を塩化メチレン(6ml)に溶解し、室温でトリフルオロ酢酸(5ml)を加え、室温にて反応溶液を2時間攪拌した。反応溶液を減圧下に濃縮後、得られた残渣をトルエンで共沸を3回繰返し、減圧下に濃縮した。得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(ヘキサン:酢酸エチルエステル=3:2)により精製し、表題化合物470mg(収率:46%)を淡黄色油状物として得た。

¹HNMR(CDCI₃) δ: 0.85(3H, d, J=6.6Hz), 1.10(3H, d, J=6.6Hz), 1.56-1.66(1H, m), 3.48(3H, s), 4.17(1H, d, J=10.5Hz), 6.83(1H, d, J=7.8Hz), 7.04(1H, t, J=7.8Hz), 7.34-7.36(1H, m), 7.38(1H, t, J=7.8Hz), 7.53-7.60(2H, m), 7.75(1H, d, J=7.8Hz), 7.89-7.92(1H, m)

FAB-MS(m/e): 338 [M+H]⁺

実施例 1001 と同様にして、前記の化合物リストの一般式 [I-1] の化合物の化合物番号に対応する実施例 1002ないし 1222、1413 及び 1427 ないし 1439 の化合物を得た。以下にこれらの物理定数を示す。



5

実施例 1002 ($R^1: H$; $R^2: H$; $R^3: i\text{-Pr}$; $R^4: H$; $Z: Ph$; $R: Ph$)

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) $\delta: 0.92$ (3H, d, $J = 6.6\text{ Hz}$), 1.11 (3H, d, $J = 6.7\text{ Hz}$), 1.56–1.67 (1H, m), 4.22 (1H, d, $J = 9.8\text{ Hz}$), 7.33 (1H, dd, $J = 2.7, 5.8\text{ Hz}$), 7.37–7.62 (7H, m), 7.92 (1H, dd, $J = 2.8, 5.8\text{ Hz}$)

FAB-MS (m/e) : 308 [$M+H]^+$

15 実施例 1003 ($R^1: H$; $R^2: H$; $R^3: i\text{-Pr}$; $R^4: H$; $Z: Ph$; $R: 2\text{-NH}_2\text{-Ph}$)

ESI-MS (m/e) : 323 [$M+H]^+$

20 実施例 1004 ($R^1: H$; $R^2: H$; $R^3: i\text{-Pr}$; $R^4: H$; $Z: Ph$; $R: 4\text{-F-Ph}$)

ESI-MS (m/e) : 326 [$M+H]^+$

実施例 1005 ($R^1: H$; $R^2: H$; $R^3: i\text{-Pr}$; $R^4: H$; $Z: Ph$; $R: 4\text{-Et}_2\text{N-Ph}$)

E S I - M S (m/e) : 379 [M+H]⁺

実施例 1006 (R¹:H; R²:H; R³:i-Pr; R⁴:H; Z:Ph; R:
4-C1-Ph)

- 5 ¹HNMR (CDCl₃) δ: 0.92 (3H, d, J=6.6Hz), 1.12
(3H, d, J=7.2Hz), 1.54-1.70 (1H, m), 4.21 (1
H, d, J=9.4Hz), 7.32 (1H, ddd, J=0.6, 2.4, 5.
4Hz), 7.37 (2H, d, J=9.0Hz), 7.43 (2H, d, J=
9.0Hz), 7.58-7.62 (2H, m), 7.91 (1H, ddd, J
10 = 0.6, 2.4, 5.4Hz)

FAB-MS (m/e) : 342 [M+H]⁺

実施例 1007 (R¹:H; R²:H; R³:i-Pr; R⁴:H; Z:Ph; R:
4-HO-Ph)

- 15 ¹HNMR (CDCl₃) δ: 0.93 (3H, d, J=6.7Hz), 1.11
(3H, d, J=6.7Hz), 1.59-1.75 (1H, m), 4.19 (1
H, d, J=9.9Hz), 6.85 (2H, d, J=8.8Hz), 7.33-
7.37 (3H, m), 7.57-7.60 (2H, m), 7.88-7.91
(1H, m)

20 FAB-MS (m/e) : 324 [M+H]⁺

実施例 1008 (R¹:H; R²:H; R³:i-Pr; R⁴:H; Z:Ph; R:
3-MeO-Ph)

- 1¹HNMR (CDCl₃) δ: 0.96 (3H, d, J=6.6Hz), 1.12
(3H, d, J=6.6Hz), 1.63-1.71 (1H, m), 3.79 (3
H, s), 4.21 (1H, d, J=9.9Hz), 6.90 (1H, ddd, J
=1.4, 8.0Hz), 7.02 (1H, d, J=1.4Hz), 7.08 (1
H, d, J=8.0Hz), 7.31 (1H, t, J=8.0Hz), 7.36-
7.38 (1H, m), 7.56-7.62 (2H, m), 7.89-7.92

(1H, m)

FAB-MS (m/e) : 338 [M+H] +

実施例 1009 (R¹:H; R²:H; R³:i-Pr; R⁴:H; Z:Ph; R:
 5 3-HO-Ph)

¹HNMR (CDCl₃) δ: 0.95 (3H, d, J=6.6Hz), 1.12
 (3H, d, J=6.6Hz), 1.67-1.72 (1H, m), 4.21 (1
 H, d, J=9.9Hz), 6.85 (1H, ddd, J=0.9, 2.5, 7.
 9Hz), 6.97 (1H, d, J=2.5Hz), 7.06 (1H, dd, J
 10 = 0.9, 7.9Hz), 7.27 (1H, t, J=7.9Hz), 7.34-
 7.38 (1H, m), 7.54-7.62 (2H, m), 7.85-7.88
 (1H, m)

FAB-MS (m/e) : 324 [M+H] +

15 実施例 1010 (R¹:H; R²:H; R³:i-Pr; R⁴:H; Z:Ph; R:
 3-NH₂-Ph)

ESI-MS (m/e) : 323 [M+H] +

実施例 1011 (R¹:H; R²:H; R³:i-Pr; R⁴:H; Z:Ph; R:
 20 4-MeO-Ph)

¹HNMR (CDCl₃) δ: 0.93 (3H, d, J=6.7Hz), 1.11
 (3H, d, J=6.7Hz), 1.63-1.69 (1H, m), 3.82 (3
 H, s), 4.19 (1H, d, J=9.9Hz), 6.89 (2H, d, J=
 8.8Hz), 7.32-7.37 (1H, m), 7.40 (2H, d, J=8.
 8Hz), 7.57-7.60 (2H, m), 7.89-7.92 (1H, m)

FAB-MS (m/e) : 338 [M+H] +

実施例 1012 (R¹:H; R²:H; R³:i-Pr; R⁴:H; Z:Ph; R:
 4-Me-Ph)

¹HNMR (CDCl₃) δ : 0. 94 (3H, d, J=6. 6Hz), 1. 11 (3H, d, J=6. 7Hz), 1. 57-1. 72 (1H, m), 2. 36 (3H, s), 4. 20 (1H, d, J=10. 0Hz), 7. 22 (1H, d, J=8. 5Hz), 7. 32-7. 36 (1H, m), 7. 37 (1H, d, J=8. 5Hz), 7. 55-7. 61 (2H, m), 7. 88-7. 95 (1H, m)

FAB-MS (m/e) : 322 [M+H]⁺

実施例1013 (R¹:H; R²:H; R³:i-Pr; R⁴:H; Z:Ph; R:3-Me-Ph)

¹HNMR (CDCl₃) δ : 0. 86 (3H, d, J=6. 7Hz), 1. 03 (3H, d, J=6. 7Hz), 1. 52-1. 60 (1H, m), 2. 27 (3H, s), 4. 13 (1H, d, J=9. 9Hz), 7. 09-7. 20 (4H, m), 7. 20-7. 29 (1H, m), 7. 47-7. 53 (2H, m), 7. 82-7. 84 (1H, m)

FAB-MS (m/e) : 322 [M+H]⁺

実施例1014 (R¹:H; R²:H; R³:i-Pr; R⁴:H; Z:Ph; R:t-BuO₂CCH₂O-Ph)

¹HNMR (CDCl₃) δ : 0. 92 (3H, d, J=6. 7Hz), 1. 10 (3H, d, J=6. 7Hz), 1. 47 (9H, s), 1. 60-1. 68 (1H, m), 4. 19 (1H, d, J=9. 9Hz), 4. 52 (2H, s), 6. 89 (2H, d, J=8. 8Hz), 7. 40 (2H, d, J=8. 8Hz), 7. 32-7. 91 (4H, m)

FAB-MS (m/e) : 438 [M+H]⁺

実施例1015 (R¹:H; R²:H; R³:i-Pr; R⁴:H; Z:Ph; R:HO₂CCH₂O-Ph)

¹HNMR (CDCl₃) δ : 0. 93 (3H, d, J=6. 6Hz), 1. 11

(3H, d, J=6. 6Hz), 1. 60-1. 70 (1H, m), 4. 19 (1H, d, J=9. 9Hz), 4. 69 (2H, s), 6. 84 (2H, d, J=9. 0Hz), 7. 43 (2H, d, J=9. 0Hz), 7. 31-7. 92 (4H, m)

5 FAB-MS (m/e) : 382 [M+H]⁺

実施例1016 (R¹:H; R²:H; R³:i-Pr; R⁴:H; Z:Ph; R:
4-tBuO₂C(CH₂)₅O-Ph)

10 ¹HNMR (CDCl₃) δ : 0. 94 (3H, d, J=6. 6Hz), 1. 11
9-1. 84 (7H, m), 2. 24 (2H, t, J=7. 2Hz), 3. 95
(2H, t, J=6. 4Hz), 4. 19 (1H, d, J=10. 1Hz), 6.
87 (2H, d, J=8. 4Hz), 7. 32-7. 35 (1H, m), 7. 3
8 (2H, d, J=8. 4Hz), 7. 55-7. 60 (2H, m), 7. 88-
15 7. 91 (1H, m)

FAB-MS (m/e) : 494 [M+H]⁺

実施例1017 (R¹:H; R²:H; R³:i-Pr; R⁴:H; Z:Ph; R:
4-HO₂C(CH₂)₅O-Ph)

20 ¹HNMR (CDCl₃) δ : 0. 83 (3H, d, J=6. 7Hz), 1. 10
(3H, d, J=6. 7Hz), 1. 47-1. 85 (7H, m), 2. 39 (2
H, t, J=7. 8Hz), 3. 85 (2H, t, J=7. 2Hz), 4. 18
(1H, d, J=10. 7Hz), 6. 87 (2H, d, J=8. 9Hz), 7.
31-7. 39 (1H, m), 7. 39 (2H, d, J=8. 9Hz), 7. 5
25 4-7. 61 (2H, m), 7. 87-7. 92 (1H, m)

FAB-MS (m/e) : 438 [M+H]⁺

実施例1018 (R¹:H; R²:H; R³:i-Pr; R⁴:H; Z:Ph; R:
4-HO (CH₂)₃O-Ph)

¹HNMR (CDCl₃) δ : 0. 93 (3H, d, J=6. 7Hz), 1. 11 (3H, d, J=6. 7Hz), 1. 61–1. 71 (1H, m), 2. 04 (2H, quintet, J=5. 9Hz), 3. 86 (2H, t, J=5. 9Hz), 4. 12 (2H, t, J=5. 9Hz), 4. 20 (1H, d, J=9. 8Hz), 5 6. 90 (2H, d, J=8. 8Hz), 7. 32–7. 91 (6H, m)
FAB-MS (m/e) : 382 [M+H]⁺

実施例1019 (R¹:H; R²:H; R³:i-Pr; R⁴:H; Z:Ph; R:
4-HO(CH₂)₂O-Ph)

10 ¹HNMR (CDCl₃) δ : 0. 95 (3H, d, J=6. 7Hz), 1. 13 (3H, d, J=6. 7Hz), 1. 63–1. 71 (1H, m), 3. 99 (2H, t, J=4. 4Hz), 4. 11 (2H, t, J=4. 4Hz), 4. 22 (1H, d, J=9. 9Hz), 6. 94 (2H, d, J=8. 9Hz), 7. 29–7. 93 (6H, m)
15 FAB-MS (m/e) : 368 [M+H]⁺

実施例1020 (R¹:H; R²:H; R³:i-Pr; R⁴:H; Z:Ph; R:
4-HOC(Me)₂(CH₂)₂O-Ph)

10 ¹HNMR (CDCl₃) δ : 0. 95 (3H, d, J=6. 7Hz), 1. 13 (3H, d, J=6. 7Hz), 1. 32 (6H, s), 1. 61–1. 68 (1H, m), 2. 01 (2H, t, J=6. 4Hz), 4. 19 (2H, t, J=6. 4Hz), 4. 21 (1H, d, J=9. 9Hz), 6. 91 (2H, d, J=8. 9Hz), 7. 41 (2H, d, J=8. 9Hz), 7. 33–7. 92 (4H, m)
25 FAB-MS (m/e) : 410 [M+H]⁺

実施例1021 (R¹:H; R²:H; R³:i-Pr; R⁴:H; Z:Ph; R:
4-PhCH₂O-Ph)

10 ¹HNMR (CDCl₃) δ : 0. 94 (3H, d, J=6. 6Hz), 1. 12

(3H, d, J=6. 6Hz), 1. 60-1. 75 (1H, m), 4. 20 (1H, d, J=9. 9Hz), 5. 06 (2H, s), 6. 98 (2H, d, J=8. 9Hz), 7. 33-7. 92 (11H, m)

FAB-MS (m/e) : 414 [M+H]⁺

5

実施例1022 (R¹:H; R²:H; R³:i-Pr; R⁴:H; Z:Ph; R:4-MeNHCOC₂O-Ph)

¹HNMR (CDCl₃) δ: 0. 92 (3H, d, J=6. 7Hz), 1. 11 (3H, d, J=6. 7Hz), 1. 60-1. 68 (1H, m), 2. 92 (3H, d, J=5. 1Hz), 4. 20 (1H, d, J=9. 9Hz), 4. 50 (2H, s), 6. 56-6. 59 (1H, m), 6. 93 (2H, d, J=8. 9Hz), 7. 32-7. 36 (1H, m), 7. 45 (2H, d, J=8. 9Hz), 7. 57-7. 63 (2H, m), 7. 90-7. 93 (1H, m)

FAB-MS (m/e) : 395 [M+H]⁺

15

実施例1023 (R¹:H; R²:H; R³:i-Pr; R⁴:H; Z:Ph; R:4-EtNHCOC₂O-Ph)

¹HNMR (CDCl₃) δ: 0. 92 (3H, d, J=6. 7Hz), 1. 11 (3H, d, J=6. 7Hz), 1. 18 (3H, t, J=7. 3Hz), 1. 60-1. 70 (1H, m), 3. 40 (2H, dt, J=5. 9, 7. 3Hz), 4. 20 (1H, d, J=9. 8Hz), 4. 48 (2H, s), 6. 53 (1H, brs), 6. 93 (2H, d, J=9. 0Hz), 7. 31-7. 92 (6H, m)

FAB-MS (m/e) : 409 [M+H]⁺

25

実施例1024 (R¹:H; R²:H; R³:i-Pr; R⁴:H; Z:Ph; R:4-n-PrNHCOC₂O-Ph)

¹HNMR (CDCl₃) δ: 0. 89-0. 94 (6H, m), 1. 12 (3H, d, J=7. 2Hz), 1. 53-1. 66 (3H, m), 3. 32 (2H, d

t, J=7. 2 Hz), 4. 21 (1H, d, J=9. 9 Hz), 4. 50 (2 H, s), 6. 53 (1H, br), 6. 95 (2H, d, J=8. 9 Hz), 7. 31-7. 93 (6H, m)

FAB-MS (m/e) : 414 [M+H]⁺

5

実施例1025 (R¹:H; R²:H; R³:i-Pr; R⁴:H; Z:Ph; R:
4-n-BuNHC(=O)CH₂O-Ph)

¹HNMR (CDCl₃) δ: 0. 92 (3H, t, J=7. 2 Hz), 0. 92 (3H, d, J=6. 6 Hz), 1. 11 (3H, d, J=6. 6 Hz), 1. 26-1. 40 (2H, m), 1. 48-1. 70 (3H, m), 3. 35 (2 H, q, J=6. 8 Hz), 4. 21 (1H, d, J=9. 8 Hz), 4. 49 (2H, s), 6. 52-6. 53 (1H, m), 6. 94 (2H, d, J=9. 0 Hz), 7. 31-7. 36 (1H, m), 7. 45 (2H, d, J=9. 0 Hz), 7. 57-7. 63 (2H, m), 7. 88-7. 93 (1H, m)

15 FAB-MS (m/e) : 437 [M+H]⁺

実施例1026 (R¹:H; R²:H; R³:i-Pr; R⁴:H; Z:Ph; R:
4-CH₂=CHCH₂NHC(=O)CH₂O-Ph)

¹HNMR (CDCl₃) δ: 0. 93 (3H, d, J=6. 7 Hz), 1. 13 (3H, d, J=6. 7 Hz), 1. 61-1. 67 (1H, m), 3. 98-4. 02 (2H, m), 4. 22 (1H, d, J=9. 8 Hz), 4. 54 (2 H, s), 5. 82-5. 91 (1H, m), 6. 65 (1H, br), 6. 96 (2H, d, J=8. 9 Hz), 7. 33-7. 94 (6H, m)

ESI-MS (m/e) : 421 [M+H]⁺

25

実施例1027 (R¹:H; R²:H; R³:i-Pr; R⁴:H; Z:Ph; R:
4-Me (CH₂)₉NHC(=O)CH₂O-Ph)

¹HNMR (CDCl₃) δ: 0. 87 (3H, t, J=6. 5 Hz), 0. 92 (3H, d, J=6. 6 Hz), 1. 11 (3H, d, J=6. 6 Hz), 1.

2.5 - 1.67 (7H, m), 3.33 (2H, dt, J=6.8Hz), 4.20 (1H, d, J=9.8Hz), 4.48 (2H, s), 6.61 (1H, br), 6.93 (2H, d, J=9.0Hz), 7.32 - 7.92 (6H, m)

5 FAB-MS (m/e) : 521 [M+H]⁺

実施例1028 (R¹:H; R²:H; R³:i-Pr; R⁴:H; Z:Ph; R:4-N₃(CH₂)₃O-Ph)

10 ¹HNMR (CDCl₃) δ: 0.96 (3H, d, J=6.6Hz), 1.14 (3H, d, J=6.6Hz), 1.60 - 1.69 (1H, m), 2.07 - 2.12 (2H, m), 3.54 (2H, t, J=6.6Hz), 4.07 (2H, t, J=6.2Hz), 4.21 (1H, d, J=9.9Hz), 6.92 (2H, d, J=8.9Hz), 7.34 - 7.94 (6H, m)

FAB-MS (m/e) : 407 [M+H]⁺

15

実施例1029 (R¹:H; R²:H; R³:i-Pr; R⁴:H; Z:Ph; R:4-t-BuO₂CCH(Me)O-Ph)

10 ¹HNMR (CDCl₃) δ: 0.91 (3H, d, J=6.7Hz), 1.10 (3H, d, J=6.7Hz), 1.38 - 1.79 (13H, m), 4.19 (1H, d, J=9.9Hz), 4.61 - 4.64 (1H, m), 6.86 (2H, d, J=8.9Hz), 7.31 - 7.34 (1H, m), 7.38 (2H, d, J=8.9Hz), 7.57 - 7.62 (2H, m), 7.88 - 7.91 (1H, m)

FAB-MS (m/e) : 452 [M+H]⁺

25

実施例1030 (R¹:H; R²:H; R³:i-Pr; R⁴:H; Z:Ph; R:4-n-PrNHCOCH(Me)O-Ph)

¹HNMR (CDCl₃) δ: 0.78 - 0.89 (3H, m), 0.95 (3H, d, J=6.8Hz), 1.11 (3H, d, J=6.8Hz), 1.40 - 1.

7.4 (6H, m), 3.11-3.32 (2H, m), 4.20 (1H, d, J=9.3Hz), 4.64-4.70 (1H, m), 6.33-6.34 (1H, m), 6.91 (2H, d, J=8.2Hz), 7.29-7.38 (1H, m), 7.39-7.43 (2H, m), 7.56-7.62 (2H, m), 7.87-
5 7.92 (1H, m)

FAB-MS (m/e) : 437 [M+H]⁺

実施例1031 (R¹:H; R²:H; R³:i-Pr; R⁴:H; Z:Ph; R:
4-F₃COSO₃-Ph)

- 10 ¹HNMR (CDCl₃) δ: 0.89 (3H, d, J=6.7Hz), 1.12
(3H, d, J=6.7Hz), 1.59-1.67 (1H, m), 4.24 (1
H, d, J=9.6Hz), 7.31-7.34 (1H, m), 7.33 (2H,
d, J=8.9Hz), 7.59-7.66 (2H, m), 7.61 (2H, d,
J=8.9Hz), 7.92-7.95 (1H, m)
15 FAB-MS (m/e) : 456 [M+H]⁺

実施例1032 (R¹:H; R²:H; R³:i-Pr; R⁴:H; Z:Ph; R:
4-t-BuO₂CCH=CH-Ph)

- 10 ¹HNMR (CDCl₃) δ: 0.91 (3H, d, J=6.6Hz), 1.11
(3H, d, J=6.6Hz), 1.44 (9H, s), 1.50-1.66 (1
H, m), 4.21 (1H, d, J=9.7Hz), 6.38 (1H, d, J=
16.0Hz), 7.32-7.36 (1H, m), 7.51-7.55 (4H,
m), 7.58-7.64 (3H, m), 7.90-7.94 (1H, m)
FAB-MS (m/e) : 434 [M+H]⁺
25

実施例1033 (R¹:H; R²:H; R³:i-Pr; R⁴:H; Z:Ph; R:
4-n-PrNHC(=O)CH=CH-Ph)

¹HNMR (CDCl₃) δ: 0.92 (3H, d, J=6.7Hz), 0.97
(3H, t, J=7.4Hz), 1.11 (3H, d, J=6.7Hz), 1.

5.6-1.75 (3H, m), 3.36 (2H, q, J=6.7Hz), 4.22 (1H, d, J=9.9Hz), 5.69 (1H, s), 6.41 (1H, d, J=15.7Hz), 7.31-7.36 (1H, m), 7.47-7.54 (4H, m), 7.59-7.63 (2H, m), 7.61 (1H, d, J=15.5Hz), 7.90-7.95 (1H, m)

FAB-MS (m/e) : 419 [M+H]⁺

実施例1034 (R¹:H; R²:H; R³:i-Pr; R⁴:H; Z:Ph; R:4-n-PrCH(Me) NHCOCH₂O-Ph)

10 ¹HNMR (CDCl₃) δ: 0.91 (3H, t, J=5.3Hz), 0.93 (3H, d, J=6.6Hz), 1.12 (3H, d, J=6.6Hz), 1.16 (3H, d, J=6.6Hz), 1.27-1.48 (4H, m), 1.61-1.69 (1H, m), 4.07-4.12 (1H, m), 4.22 (1H, d, J=9.8Hz), 4.48 (2H, s), 6.26 (1H, br), 6.95 (2H, d, J=8.9Hz), 7.32-7.94 (6H, m)

FAB-MS (m/e) : 451 [M+H]⁺

実施例1035 (R¹:H; R²:H; R³:i-Pr; R⁴:H; Z:Ph; R:4-EtCH(Me) NHCOCH₂O-Ph)

20 ¹HNMR (CDCl₃) δ: 0.87 (3H, t, J=7.5Hz), 0.92 (3H, d, J=6.6Hz), 1.11 (3H, d, J=6.7Hz), 1.15 (3H, d, J=6.6Hz), 1.46-1.52 (2H, m), 1.60-1.70 (1H, m), 3.98-4.03 (1H, m), 4.21 (1H, d, J=9.8Hz), 4.48 (2H, s), 6.24 (1H, br), 6.94 (2H, d, J=8.9Hz), 7.31-7.93 (6H, m)

FAB-MS (m/e) : 437 [M+H]⁺

実施例1036 (R¹:H; R²:H; R³:i-Pr; R⁴:H; Z:Ph; R:4-MeOCH₂O-Ph)

¹HNMR (CDCl₃) δ : 0. 97 (3H, d, J=6. 9Hz), 1. 13
 (3H, d, J=6. 9Hz), 1. 60-1. 70 (1H, m), 3. 49 (3
 H, s), 4. 20 (1H, d, J=9. 6Hz), 5. 19 (2H, s), 7.
 05 (2H, d, J=8. 4Hz), 7. 35-7. 93 (6H, m)

5 ESI-MS (m/e) : 368 [M+H]⁺

実施例1037 (R¹:H; R²:H; R³:i-Pr; R⁴:H; Z:Ph; R:
 4-EtCOCH₂O-Ph)

¹HNMR (CDCl₃) δ : 0. 93 (3H, d, J=6. 6Hz), 1. 12
 10 (3H, d, J=6. 6Hz), 1. 12 (3H, t, J=7. 3Hz), 1.
 60-1. 68 (1H, m), 2. 26 (2H, q, J=7. 3Hz), 4. 2
 0 (1H, d, J=9. 9Hz), 4. 58 (2H, s), 6. 89 (2H, d,
 J=8. 9Hz), 7. 32-7. 92 (6H, m)

ESI-MS (m/e) : 394 [M+H]⁺

15

実施例1038 (R¹:H; R²:H; R³:i-Pr; R⁴:H; Z:Ph; R:
 3-tBuO₂CCH₂O-Ph)

¹HNMR (CDCl₃) δ : 0. 94 (3H, d, J=6. 7Hz), 1. 11
 (3H, d, J=6. 7Hz), 1. 46 (9H, s), 1. 61-1. 73 (1
 20 H, m), 4. 20 (1H, d, J=9. 9Hz), 4. 50 (2H, s), 6.
 89 (1H, dd, J=2. 3, 8. 1Hz), 7. 02 (1H, dd, J=1.
 1, 2. 3Hz), 7. 10 (1H, dd, J=1. 1, 8. 1Hz), 7. 3
 1 (1H, t, J=8. 1Hz), 7. 33-7. 37 (1H, m), 7. 56-
 7. 61 (2H, m), 7. 87-7. 92 (1H, m)

25 FAB-MS (m/e) : 438 [M+H]⁺

実施例1039 (R¹:H; R²:H; R³:i-Pr; R⁴:H; Z:Ph; R:
 3-HO₂CCH₂O-Ph)

¹HNMR (CDCl₃) δ : 0. 93 (3H, d, J=6. 6Hz), 1. 10

(3H, d, J=6. 6Hz), 1. 59-1. 69 (1H, m), 4. 20 (1H, d, J=9. 0Hz), 4. 68 (2H, s), 6. 90-6. 94 (1H, m), 7. 08-7. 26 (3H, m), 7. 31-7. 36 (1H, m), 7. 57-7. 62 (2H, m), 7. 88-7. 93 (1H, m)

5 FAB-MS (m/e) : 382 [M+H]⁺

実施例1040 (R¹:H; R²:H; R³:i-Pr; R⁴:H; Z:Ph; R:3-n-PrNHCOCH₂O-Ph)

¹HNMR (CDCl₃) δ: 0. 93 (3H, t, J=7. 4Hz), 0. 94 (3H, d, J=6. 6Hz), 1. 12 (3H, d, J=6. 6Hz), 1. 52-1. 72 (3H, m), 3. 32 (2H, q, J=6. 8Hz), 4. 22 (1H, d, J=9. 8Hz), 4. 47 (2H, s), 6. 56-6. 58 (1H, m), 6. 91 (1H, dd, J=2. 2, 7. 6Hz), 7. 11 (1H, dd, J=1. 1, 2. 2Hz), 7. 14 (1H, dd, J=1. 1, 7. 8Hz), 7. 33-7. 38 (2H, m), 7. 58-7. 64 (2H, m), 7. 91-7. 94 (1H, m)

FAB-MS (m/e) : 423 [M+H]⁺

実施例1041 (R¹:H; R²:H; R³:i-Pr; R⁴:H; Z:Ph; R:4-H₂NC(Me)₂CH₂O₂CCH₂O-Ph)

FAB-MS (m/e) : 453 [M+H]⁺

実施例1042 (R¹:H; R²:H; R³:i-Pr; R⁴:H; Z:Ph; R:4-morpholinocOCH₂O-Ph)

¹HNMR (CDCl₃) δ: 0. 94 (3H, d, J=6. 7Hz), 1. 13 (3H, d, J=6. 7Hz), 1. 60-1. 68 (1H, m), 3. 59-3. 69 (8H, m), 4. 21 (1H, d, J=9. 8Hz), 4. 72 (2H, s), 6. 96 (2H, d, J=9. 0Hz), 7. 33-7. 93 (6H, m)

E S I - M S (m/e) : 451 [M+H] +

実施例 1043 (R¹:H; R²:H; R³:i-Pr; R⁴:H; Z:Ph; R:
4-(4-Cl-Ph)-COCH₂O-Ph)

5 ¹HNMR (CDCl₃) δ: 0.93 (3H, d, J=6.6 Hz), 1.11
(3H, d, J=6.6 Hz), 1.62-1.66 (1H, m), 4.19 (1
H, d, J=9.9 Hz), 5.25 (2H, s), 6.93 (2H, d, J=
8.9 Hz), 7.32-7.97 (10H, m)

E S I - M S (m/e) : 476 [M+H] +

10

実施例 1044 (R¹:H; R²:H; R³:i-Pr; R⁴:H; Z:Ph; R:
4-PhCOCH₂O-Ph)

15 ¹HNMR (CDCl₃) δ: 0.93 (3H, d, J=6.7 Hz), 1.11
(3H, d, J=6.7 Hz), 1.61-1.70 (1H, m), 4.19 (1
H, d, J=9.9 Hz), 5.31 (2H, s), 6.94 (2H, d, J=
9.0 Hz), 7.33-8.01 (11H, m)

E S I - M S (m/e) : 442 [M+H] +

20

実施例 1045 (R¹:H; R²:H; R³:i-Pr; R⁴:H; Z:Ph; R:
4-(4-pyridyl)-CH₂NHCOCH₂O-Ph)

25 ¹HNMR (CDCl₃) δ: 0.92 (3H, d, J=6.5 Hz), 1.12
(3H, d, J=6.5 Hz), 1.61-1.67 (1H, m), 4.21 (1
H, d, J=9.7 Hz), 4.57 (1H, d, J=6.4 Hz), 4.60
(2H, s), 6.96 (2H, d, J=8.9 Hz), 7.20-8.57 (1
OH, m)

E S I - M S (m/e) : 472 [M+H] +

実施例 1046 (R¹:H; R²:H; R³:i-Pr; R⁴:H; Z:Ph; R:
4-H₂NCH₂CH₂NHCOCH₂O-Ph)

¹HNMR (methanol-d₄) δ : 0. 87 - 1. 09 (6H, m), 1. 57 - 2. 15 (1H, m), 3. 06 - 3. 12 (2H, m), 3. 52 - 3. 59 (2H, m), 4. 20 (1H, d, J = 9. 5 Hz), 4. 54 - 4. 64 (2H, m), 6. 90 - 7. 91 (8H, m)

5 FAB-MS (m/e) : 424 [M+H]⁺

実施例1047 (R¹:H; R²:H; R³:i-Pr; R⁴:H; Z:Ph; R:
4-C1-3-NO₂-Ph)
ESI-MS (m/e) : 387 [M+H]⁺

10

実施例1048 (R¹:H; R²:H; R³:i-Pr; R⁴:H; Z:Ph; R:
4-C1-3-F-Ph)

¹HNMR (CDCl₃) δ : 0. 94 (3H, d, J = 6. 6 Hz), 1. 13
(3H, d, J = 6. 6 Hz), 1. 59 - 1. 72 (1H, m), 4. 22 (1
15 H, d, J = 9. 4 Hz), 7. 24 - 7. 36 (3H, m), 7. 44 (1H,
t, J = 7. 7 Hz), 7. 59 - 7. 65 (2H, m), 7. 90 - 7. 94
(1H, m)

FAB-MS (m/e) : 360 [M+H]⁺

20 実施例1049 (R¹:H; R²:H; R³:i-Pr; R⁴:H; Z:Ph; R:
4-C1-3-Me-Ph)

¹HNMR (CDCl₃) δ : 0. 94 (3H, d, J = 6. 7 Hz), 1. 12
(3H, d, J = 6. 7 Hz), 1. 58 - 1. 72 (1H, m), 2. 38 (3
H, s), 4. 20 (1H, d, J = 9. 9 Hz), 7. 21 - 7. 27 (1H,
25 m), 7. 31 - 7. 35 (1H, m), 7. 35 (2H, d, J = 8. 5 Hz),
7. 57 - 7. 63 (2H, m), 7. 88 - 7. 95 (1H, m)

FAB-MS (m/e) : 356 [M+H]⁺

実施例 1050 (R¹:H; R²:H; R³:i-Pr; R⁴:H; Z:Ph; R:
3-NH₂-4-C1-Ph)

¹HNMR (CDCl₃) δ: 0.96 (3H, d, J=6.6 Hz), 1.13
(3H, d, J=6.5 Hz), 1.60-1.77 (1H, m), 4.19 (1
5 H, d, J=9.9 Hz), 6.75 (1H, dd, J=2.4, 8.2 Hz),
6.92 (1H, d, J=2.4, Hz), 7.23 (1H, d, J=8.2,
Hz), 7.33-7.39 (1H, m), 7.57-7.63 (2H, m),
7.86-7.93 (1H, m)

FAB-MS (m/e) : 357 [M+H]⁺

10

実施例 1051 (R¹:H; R²:H; R³:i-Pr; R⁴:H; Z:Ph; R:
3-C1-4-MeO-Ph)

¹HNMR (CDCl₃) δ: 0.95 (3H, d, J=6.7 Hz), 1.13
(3H, d, J=6.7 Hz) 1.57-1.65 (1H, m), 3.91 (3
15 H, s), 4.20 (1H, d, J=9.9 Hz), 6.92 (1H, d, J=
8.6 Hz), 7.33-7.93 (6H, m)

FAB-MS (m/e) : 372 [M+H]⁺

20

実施例 1052 (R¹:H; R²:H; R³:i-Pr; R⁴:H; Z:Ph; R:
3-C1-4-Me-Ph)

¹HNMR (CDCl₃) δ: 0.95 (3H, d, J=6.7 Hz), 1.12
(3H, d, J=6.7 Hz), 1.62-1.69 (1H, m), 2.37 (3
H, s), 4.20 (1H, d, J=9.8 Hz), 7.26-7.33 (2H,
m), 7.33-7.36 (1H, m), 7.49 (1H, s), 7.57-7.
25 62 (2H, m), 7.89-7.93 (1H, m)

FAB-MS (m/e) : 356 [M+H]⁺

実施例 1053 (R¹:H; R²:H; R³:i-Pr; R⁴:H; Z:Ph; R:
4-Br-3-C1-Ph)

¹HNMR (CDCl₃) δ : 0. 88 (3H, d, J=6. 7Hz), 1. 12 (3H, d, J=6. 7Hz), 1. 50-1. 60 (1H, m), 4. 24 (1H, d, J=9. 6Hz), 7. 50-7. 95 (7H, m)
FAB-MS (m/e) : 420/422 [M+H]⁺

5

実施例1054 (R¹:H; R²:H; R³:i-Pr; R⁴:H; Z:Ph; R:
4-Br-2-C1-Ph)

¹HNMR (CDCl₃) δ : 0. 94 (3H, d, J=6. 6Hz), 1. 13 (3H, d, J=6. 5Hz), 1. 62-1. 67 (1H, m), 4. 22 (1H, d, J=9. 7Hz), 7. 22-7. 94 (7H, m)
FAB-MS (m/e) : 420/422 [M+H]⁺

実施例1055 (R¹:H; R²:H; R³:i-Pr; R⁴:H; Z:Ph; R:
4-F-3-Me-Ph)

15 ¹HNMR (CDCl₃) δ : 0. 93 (3H, d, J=6. 7Hz), 1. 12 (3H, d, J=6. 7Hz), 1. 61-1. 68 (1H, m), 2. 28 (3H, s), 4. 20 (1H, d, J=9. 9Hz), 7. 01 (1H, t, J=8. 9Hz), 7. 27-7. 35 (3H, m), 7. 59-7. 62 (2H, m), 7. 90-7. 93 (1H, m)
20 FAB-MS (m/e) : 340 [M+H]⁺

実施例1056 (R¹:H; R²:H; R³:i-Pr; R⁴:H; Z:Ph; R:
3-F-4-Me-Ph)

15 ¹HNMR (CDCl₃) δ : 0. 94 (3H, d, J=6. 7Hz), 1. 12 (3H, d, J=6. 7Hz), 1. 63-1. 70 (1H, m), 2. 28 (3H, s), 4. 21 (1H, d, J=9. 9Hz), 7. 16 (1H, d, J=7. 2Hz), 7. 18 (1H, s), 7. 20 (1H, d, J=7. 2Hz), 7. 33-7. 36 (1H, m), 7. 57-7. 63 (2H, m), 7. 90-7. 93 (1H, m)

FAB-MS (m/e) : 340 [M+H]⁺

実施例1057 (R¹:H; R²:H; R³:i-Pr; R⁴:H; Z:Ph; R:
3-Br-4-HO-Ph)

- 5 ¹HNMR (CDCl₃) δ: 0.95 (3H, d, J=6.6Hz), 1.13
(3H, d, J=6.6Hz), 1.62-1.72 (1H, m), 4.20 (1
H, d, J=9.9Hz), 5.70 (1H, s), 7.02 (1H, d, J=
8.6Hz), 7.30-7.37 (1H, m), 7.32 (1H, d, J=8.
6Hz), 7.58-7.65 (2H, m), 7.64 (1H, s), 7.90-
10 7.93 (1H, m)

FAB-MS (m/e) : 402/404 [M+H]⁺

実施例1058 (R¹:H; R²:H; R³:i-Pr; R⁴:H; Z:Ph; R:
3-Br-4-MeO-Ph)

- 15 ¹HNMR (CDCl₃) δ: 0.95 (3H, d, J=6.7Hz), 1.13
(3H, d, J=6.7Hz), 1.61-1.73 (1H, m), 3.91 (3
H, s), 4.20 (1H, d, J=9.9Hz), 6.90 (1H, d, J=
8.6Hz), 7.32-7.38 (1H, m), 7.42 (1H, dd, J=
2.3, 8.6Hz), 7.58-7.64 (2H, m), 7.66 (1H, d,
J=2.3Hz), 7.88-7.94 (1H, m)

FAB-MS (m/e) : 416/418 [M+H]⁺

実施例1059 (R¹:H; R²:H; R³:i-Pr; R⁴:H; Z:Ph; R:
3-Br-4-F-Ph)

- 25 ESI-MS (m/e) : 404 [M+H]⁺

実施例1060 (R¹:H; R²:H; R³:i-Pr; R⁴:H; Z:Ph; R:
3-F-4-Ph-Ph)

¹HNMR (CDCl₃) δ: 0.88 (3H, d, J=6.5Hz), 1.15

(3H, d, J=6. 5Hz), 1. 65-1. 80 (1H, m), 4. 23 (1H, d, J=9. 9Hz), 7. 28-7. 56 (9H, m), 7. 56-7. 66 (2H, m), 7. 91-7. 95 (1H, m)

FAB-MS (m/e) : 402 [M+H]⁺

5

実施例1061 (R¹:H; R²:H; R³:i-Pr; R⁴:H; Z:Ph; R:4-HO-3-I-Ph)

¹HNMR (CDCl₃) δ: 0. 95 (3H, d, J=6. 6Hz), 1. 13 (3H, d, J=6. 6Hz), 1. 63-1. 69 (1H, m), 4. 19 (1H, d, J=9. 9Hz), 5. 71 (1H, s), 6. 98 (1H, d, J=8. 5Hz), 7. 32-7. 93 (6H, m)

FAB-MS (m/e) : 450 [M+H]⁺

実施例1062 (R¹:H; R²:H; R³:i-Pr; R⁴:H; Z:Ph; R:5-HO-2-I-Ph)

¹HNMR (CDCl₃) δ: 0. 95 (3H, d, J=6. 7Hz), 1. 12 (3H, d, J=6. 7Hz), 1. 63-1. 75 (1H, m), 4. 20 (1H, d, J=9. 9Hz), 6. 04 (1H, brs), 6. 82 (1H, dd, J=2. 1, 8. 2Hz), 7. 11 (1H, d, J=2. 1Hz), 7. 33-7. 36 (1H, m), 7. 55-7. 62 (2H, m), 7. 69 (1H, d, J=8. 2Hz), 7. 84-7. 87 (1H, m)

FAB-MS (m/e) : 450 [M+H]⁺

実施例1063 (R¹:H; R²:H; R³:i-Pr; R⁴:H; Z:Ph; R:3-I-4-MeO-Ph)

¹HNMR (CDCl₃) δ: 0. 96 (3H, d, J=6. 6Hz), 1. 13 (3H, d, J=6. 6Hz), 1. 59-1. 68 (1H, m), 3. 89 (3H, s), 4. 20 (1H, d, J=9. 9Hz), 6. 81 (1H, d, J=8. 6Hz), 7. 34-7. 93 (6H, m)

FAB-MS (m/e) : 464 [M+H]⁺

実施例1064 (R¹:H; R²:H; R³:i-Pr; R⁴:H; Z:Ph; R:
2-I-5-MeO-Ph)

- 5 ¹HNMR (CDCl₃) δ: 0.98 (3H, d, J=6.6Hz), 1.13
(3H, d, J=6.6Hz), 1.63-1.71 (1H, m), 3.86 (3
H, s), 4.22 (1H, d, J=10.1Hz), 6.87 (1H, dd,
J=1.9, 8.0Hz), 6.91 (1H, d, J=1.9Hz), 7.35-
7.37 (1H, m), 7.58-7.64 (2H, m), 7.79 (1H, d,
J=8.0Hz), 7.92 (1H, dd, J=3.0, 5.7Hz)

FAB-MS (m/e) : 464 [M+H]⁺

実施例1065 (R¹:H; R²:H; R³:i-Pr; R⁴:H; Z:Ph; R:
4-MeO-3-Me-Ph)

- 15 ¹HNMR (CDCl₃) δ: 0.95 (3H, d, J=6.6Hz), 1.11
(3H, d, J=6.6Hz), 1.60-1.70 (1H, m), 2.18 (3
H, s), 3.83 (3H, s), 4.18 (1H, d, J=10.0Hz),
6.80 (1H, d, J=8.6Hz), 7.20 (1H, d, J=2.6Hz),
7.30 (1H, dd, J=2.6, 8.6Hz), 7.32-7.36 (1H,
m), 7.54-7.61 (2H, m), 7.88-7.92 (1H, m)

FAB-MS (m/e) : 352 [M+H]⁺

実施例1066 (R¹:H; R²:H; R³:i-Pr; R⁴:H; Z:Ph; R:
4-HO(CH₂)₃O-3-I-Ph)

- 25 ¹HNMR (CDCl₃) δ: 0.97 (3H, d, J=6.7Hz), 1.14
(3H, d, J=6.7Hz), 1.57-1.70 (1H, m), 2.13 (2
H, dt, J=5.6Hz), 3.95 (2H, t, J=5.6Hz), 4.20
(2H, t, J=5.6Hz), 4.21 (1H, d, J=9.9Hz), 6.
83 (1H, d, J=8.6Hz), 7.35-7.94 (6H, m)

FAB-MS (m/e) : 508 [M+H]⁺

実施例1067 (R¹:H; R²:H; R³:i-Pr; R⁴:H; Z:Ph; R:
4-HO(CH₂)₂O-3-I-Ph)

5 ¹HNMR (CDCl₃) δ: 0.96 (3H, d, J=6.7Hz), 1.15
(3H, d, J=6.7Hz), 1.58-1.68 (1H, m), 4.01 (2
H, t, J=4.4Hz), 4.15 (2H, t, J=4.4Hz), 4.21
(1H, d, J=9.9Hz), 6.83 (1H, d, J=8.6Hz), 7.
34-7.94 (6H, m)

10 FAB-MS (m/e) : 494 [M+H]⁺

実施例1068 (R¹:H; R²:H; R³:i-Pr; R⁴:H; Z:Ph; R:
4-HOC(Me)₂(CH₂)₂O-3-I-Ph)

15 ¹HNMR (CDCl₃) δ: 0.96 (3H, d, J=6.6Hz), 1.13
(3H, d, J=6.6Hz), 1.34 (6H, s), 1.60-1.65 (1
H, m), 2.08 (2H, t, J=6.0Hz), 4.19 (1H, d, J=
9.9Hz), 4.23 (2H, t, J=6.0Hz), 6.82 (1H, d,
J=8.7Hz), 7.32-7.94 (6H, m)

FAB-MS (m/e) : 536 [M+H]⁺

20

実施例1069 (R¹:H; R²:H; R³:i-Pr; R⁴:H; Z:Ph; R:
4-t-BuO₂C(CH₂)₄O-3-I-Ph)

15 ¹HNMR (CDCl₃) δ: 0.95 (3H, d, J=6.6Hz), 1.12
(3H, d, J=6.6Hz), 1.44 (9H, s), 1.60-1.67 (1
H, m), 1.82-1.86 (4H, m), 2.32 (2H, t, J=6.8
Hz), 4.01 (2H, t, J=5.3Hz), 4.18 (1H, d, J=1
0.0Hz), 6.75 (1H, d, J=8.6Hz), 7.32-7.91 (6
H, m)

FAB-MS (m/e) : 606 [M+H]⁺

実施例 1070 (R¹:H; R²:H; R³:i-Pr; R⁴:H; Z:Ph; R:
3-I-4-PhCH₂O-Ph)

¹HNMR (CDCl₃) δ: 0. 96 (3H, d, J=6. 7Hz), 1. 13
(3H, d, J=6. 7Hz), 1. 60-1. 75 (1H, m), 4. 20 (1
5 H, d, J=9. 9Hz), 5. 16 (2H, s), 6. 86 (1H, d, J=
8. 6Hz), 7. 34-7. 93 (11H, m)
FAB-MS (m/e) : 540 [M+H]⁺

実施例 1071 (R¹:H; R²:H; R³:i-Pr; R⁴:H; Z:Ph; R:
10 4-H₂NCOCH₂O-3-I-Ph)

¹HNMR (CDCl₃) δ: 0. 95 (3H, d, J=6. 7Hz), 1. 13
(3H, d, J=6. 7Hz), 1. 61-1. 69 (1H, m), 4. 21 (1
15 H, d, J=9. 9Hz), 4. 53 (2H, s), 5. 86 (1H, br),
6. 78 (1H, d, J=8. 6Hz), 6. 86 (1H, br), 7. 33-
7. 94 (6H, m)
FAB-MS (m/e) : 507 [M+H]⁺

実施例 1072 (R¹:H; R²:H; R³:i-Pr; R⁴:H; Z:Ph; R:
3-I-4-MeNHCOCH₂O-Ph)

²⁰ ¹HNMR (CDCl₃) δ: 0. 95 (3H, d, J=6. 6Hz), 1. 13
(3H, d, J=6. 6Hz), 1. 61-1. 69 (1H, m), 2. 97 (3
H, d, J=5. 0Hz), 4. 21 (1H, d, J=9. 8Hz), 4. 53
(2H, s), 6. 77 (1H, d, J=8. 6Hz), 6. 87 (1H, br),
7. 33-7. 94 (6H, m)
25 FAB-MS (m/e) : 521 [M+H]⁺

実施例 1073 (R¹:H; R²:H; R³:i-Pr; R⁴:H; Z:Ph; R:
4-EtNHCOCH₂O-3-I-Ph)

¹HNMR (CDCl₃) δ: 0. 95 (3H, d, J=6. 6Hz), 1. 13

(3H, d, J=6. 6Hz), 1. 24 (3H, t, J=7. 3Hz), 1.
 61-1. 69 (1H, m), 3. 44 (2H, dt, J=7. 3Hz), 4.
 21 (1H, d, J=9. 8Hz), 4. 51 (2H, s), 6. 77 (1H,
 d, J=8. 6Hz), 6. 89 (1H, br), 7. 33-7. 94 (6H,
 5 m)

FAB-MS (m/e) : 535 [M+H]⁺

実施例1074 (R¹:H; R²:H; R³:i-Pr; R⁴:H; Z:Ph; R:
 3-I-4-n-PrNHC(=O)CH₂O-Ph)

10 ¹HNMR (CDCl₃) δ: 0. 97 (3H, t, J=7. 8Hz), 1. 00
 (3H, d, J=6. 7Hz), 1. 13 (3H, d, J=6. 7Hz), 1.
 57-1. 69 (3H, m), 3. 37 (2H, dt, J=7. 0Hz), 4.
 22 (1H, d, J=9. 8Hz), 4. 52 (2H, s), 6. 78 (1H,
 d, J=8. 6Hz), 6. 91 (1H, br), 7. 33-7. 94 (6H,
 15 m)

FAB-MS (m/e) : 549 [M+H]⁺

実施例1075 (R¹:H; R²:H; R³:i-Pr; R⁴:H; Z:Ph; R:
 3-I-4-i-PrNHC(=O)CH₂O-Ph)

20 ¹HNMR (CDCl₃) δ: 0. 95 (3H, d, J=6. 6Hz), 1. 13
 (3H, d, J=6. 6Hz), 1. 25 (6H, d, J=6. 3Hz), 1.
 61-1. 69 (1H, m), 4. 11-4. 20 (1H, m), 4. 21 (1
 H, d, J=9. 8Hz), 4. 49 (2H, s), 6. 77 (1H, br),
 6. 77 (1H, d, J=9. 8Hz), 7. 33-7. 94 (6H, m)

25 FAB-MS (m/e) : 549 [M+H]⁺

実施例1076 (R¹:H; R²:H; R³:i-Pr; R⁴:H; Z:Ph; R:
 4-n-BuNHC(=O)CH₂O-3-I-Ph)

¹HNMR (CDCl₃) δ: 0. 92-0. 97 (6H, m), 1. 12 (3H,

d, J=6. 8 Hz), 1. 35-1. 68 (5H, m), 3. 39 (2H, d t, J=6. 3 Hz), 4. 20 (1H, d, J=9. 9 Hz), 4. 51 (2 H, s), 6. 76 (1H, d, J=8. 6 Hz), 6. 90 (1H, br), 7. 32-7. 93 (6H, m)

5 FAB-MS (m/e) : 563 [M+H]⁺

実施例1077 (R¹:H; R²:H; R³:i-Pr; R⁴:H; Z:Ph; R:4-t-BuNHCOCH₂O-3-I-Ph)

10 ¹HNMR (CDCl₃) δ: 0. 94 (3H, d, J=6. 7 Hz), 1. 13 (3H, d, J=6. 7 Hz), 1. 44 (9H, s), 1. 61-1. 69 (1 H, m), 4. 21 (1H, d, J=9. 8 Hz), 4. 40 (2H, s), 6. 76 (1H, d, J=8. 6 Hz), 6. 86 (1H, br), 7. 33-7. 94 (6H, m)

FAB-MS (m/e) : 563 [M+H]⁺

15

実施例1078 (R¹:H; R²:H; R³:i-Pr; R⁴:H; Z:Ph; R:4-i-BuNHCOCH₂O-Ph)

20 ¹HNMR (CDCl₃) δ: 0. 88-0. 96 (9H, m), 1. 11 (3H, d, J=6. 7 Hz), 1. 60-1. 83 (2H, m), 3. 18 (2H, t, J=6. 5 Hz), 4. 20 (1H, d, J=9. 8 Hz), 4. 51 (2H, s), 6. 54 (1H, br), 6. 95 (2H, d, J=8. 9 Hz), 7. 31-7. 93 (6H, m)

FAB-MS (m/e) : 437 [M+H]⁺

25 実施例1079 (R¹:H; R²:H; R³:i-Pr; R⁴:H; Z:Ph; R:4-t-BuO₂CCH₂O-3-I-Ph)

¹HNMR (CDCl₃) δ: 0. 96 (3H, d, J=6. 6 Hz), 1. 13 (3H, d, J=6. 6 Hz), 1. 48 (9H, s), 1. 51-1. 68 (1 H, m), 4. 20 (1H, d, J=9. 9 Hz), 4. 61 (2H, s), 6.

6.9 (1H, d, J=8.6Hz), 7.34-7.94 (6H, m)

FAB-MS (m/e) : 564 [M+H]⁺

実施例1080 (R¹:H; R²:H; R³:i-Pr; R⁴:H; Z:Ph; R:
5 3-I-4-PhCH₂NHCOCH₂O-Ph)

¹HNMR (CDCl₃) δ: 0.94 (3H, d, J=6.7Hz), 1.13
(3H, d, J=6.7Hz), 1.63-1.66 (1H, m), 4.20 (1
H, d, J=9.8Hz), 4.58 (2H, s), 4.59 (2H, d, J=
5.5Hz), 6.79 (1H, d, J=8.6Hz), 7.27-7.94 (1
10 1H, m)

FAB-MS (m/e) : 597 [M+H]⁺

実施例1081 (R¹:H; R²:H; R³:i-Pr; R⁴:H; Z:Ph; R:
3-I-4-(2-tetrahydrafuryl)CH₂NHCOCH₂O-
15 Ph)

¹HNMR (CDCl₃) δ: 0.96 (3H, d, J=6.6Hz), 1.14
(3H, d, J=6.6Hz), 1.56-2.06 (5H, m), 3.38-
4.14 (5H, m), 4.22 (1H, d, J=9.8Hz), 4.54 (2
H, s), 6.78 (1H, d, J=8.6Hz), 7.23 (1H, br),
20 7.33-7.96 (6H, m)

ESI-MS (m/e) : 591 [M+H]⁺

実施例1082 (R¹:H; R²:H; R³:i-Pr; R⁴:H; Z:Ph; R:
4-cycloPrNHCOCH₂O-3-I-Ph)

25 ¹HNMR (CDCl₃) δ: 0.61-0.64 (2H, m), 0.85-0.
89 (2H, m), 0.95 (3H, d, J=6.7Hz), 1.14 (3H,
d, J=6.7Hz), 1.62-1.67 (1H, m), 2.84-2.88
(1H, m), 4.22 (1H, d, J=9.9Hz), 4.51 (2H, s),
6.76 (1H, d, J=8.6Hz), 7.00 (1H, br), 7.33-

7. 95 (6H, m)

FAB-MS (m/e) : 547 [M+H]⁺

実施例1083 (R¹:H; R²:H; R³:i-Pr; R⁴:H; Z:Ph; R:
 5 4-cyclopentylNHCOCH₂O-3-I-Ph)
¹HNMR (CDCl₃) δ: 0.95 (3H, d, J=6.6Hz), 1.13
 (3H, d, J=6.6Hz), 1.50-1.77 (7H, m), 2.00-
 2.03 (2H, m), 4.22 (1H, d, J=9.6Hz), 4.24-4.
 36 (1H, m), 4.50 (2H, s), 6.77 (1H, d, J=8.6H
 10 z), 6.95 (1H, br), 7.33-7.94 (6H, m)
 FAB-MS (m/e) : 575 [M+H]⁺

実施例1084 (R¹:H; R²:H; R³:i-Pr; R⁴:H; Z:Ph; R:
 4-cyclohexylNHCOCH₂O-3-I-P)
 15 ¹HNMR (CDCl₃) δ: 0.94 (3H, d, J=6.7Hz), 1.12
 (3H, d, J=6.7Hz), 1.26-1.97 (11H, m), 3.89-
 3.93 (1H, m), 4.21 (1H, d, J=9.7Hz), 4.99 (2
 H, s), 6.77 (1H, d, J=8.6Hz), 6.89 (1H, brd,
 J=10.0Hz), 7.33-7.93 (6H, m)
 20 FAB-MS (m/e) : 589 [M+H]⁺

実施例1085 (R¹:H; R²:H; R³:i-Pr; R⁴:H; Z:Ph; R:
 4-cyclopentylnNHCOCH₂O-3-F-Ph)
¹HNMR (CDCl₃) δ: 0.57-0.59 (2H, m), 0.83-0.
 25 88 (2H, m), 0.93 (3H, d, J=6.6Hz), 1.13 (3H,
 d, J=6.6Hz), 1.60-1.68 (1H, m), 2.75-2.83
 (1H, m), 4.21 (1H, d, J=9.7Hz), 4.51 (2H, s),
 6.68 (1H, br), 6.92-7.93 (7H, m)
 ESI-MS (m/e) : 439 [M+H]⁺

実施例 1086 (R¹:H; R²:H; R³:i-Pr; R⁴:H; Z:Ph; R:
4-Me (CH₂)₉NHCOCH₂O-3-I-Ph)

¹HNMR (CDCl₃) δ: 0.88 (3H, t, J=6.3Hz), 0.95
(3H, d, J=6.6Hz), 1.13 (3H, d, J=6.6Hz), 1.
5 2.0-1.40 (14H, m), 1.56-1.70 (3H, m), 3.38 (2
H, dt, J=6.6Hz), 4.20 (1H, d, J=9.9Hz), 4.5
1 (2H, s), 6.77 (1H, d, J=8.6Hz), 6.92 (1H, b
r), 7.33-7.94 (6H, m)

FAB-MS (m/e) : 647 [M+H]⁺

10

実施例 1087 (R¹:H; R²:H; R³:i-Pr; R⁴:H; Z:Ph; R:
4-HO₂CCH₂O-3-I-Ph)

¹HNMR (CDCl₃) δ: 0.96 (3H, d, J=6.6Hz), 1.13
(3H, d, J=6.6Hz), 1.51-1.68 (1H, m), 4.20 (1
H, d, J=9.9Hz), 4.61 (2H, s), 6.69 (1H, d, J=
8.6Hz), 7.34-7.94 (6H, m)

FAB-MS (m/e) : 508 [M+H]⁺

実施例 1088 (R¹:H; R²:H; R³:i-Pr; R⁴:H; Z:Ph; R:
4-N₃ (CH₂)₃O-3-I-Ph)

¹HNMR (CDCl₃) δ: 0.97 (3H, d, J=6.6Hz), 1.13
(3H, d, J=6.6Hz), 1.60-1.68 (1H, m), 2.09-
2.13 (2H, m), 3.63 (2H, t, J=6.5Hz), 4.11 (2
H, t, J=5.3Hz), 4.20 (1H, d, J=9.9Hz), 6.79
(1H, d, J=8.6Hz), 7.34-7.94 (6H, m)

FAB-MS (m/e) : 533 [M+H]⁺

実施例 1089 (R¹:H; R²:H; R³:i-Pr; R⁴:H; Z:Ph; R:
3-I-4-n-PrNHCO (CH₂)₄O-Ph)

¹HNMR (CDCl₃) δ : 0. 92 (3H, t, J=7. 4Hz), 0. 96 (3H, d, J=6. 7Hz), 1. 13 (3H, d, J=6. 7Hz), 1. 45–1. 55 (2H, m), 1. 62–1. 69 (1H, m), 1. 87–1. 92 (4H, m), 2. 28–2. 32 (2H, m), 3. 21 (2H, dt, J=7. 0Hz), 4. 02–4. 09 (2H, br), 4. 20 (1H, d, J=9. 9Hz), 5. 51 (1H, br), 6. 77 (1H, d, J=8. 6Hz), 7. 34–7. 93 (6H, m)
 FAB-MS (m/e) : 591 [M+H]⁺

10 実施例1090 (R¹:H; R²:H; R³:i-Pr; R⁴:H; Z:Ph; R:
 4-Et₂NCOCH₂O-3-I-Ph)
¹HNMR (CDCl₃) δ : 0. 95 (3H, d, J=6. 6Hz), 1. 12 (6H, m), 1. 22 (3H, t, J=7. 0Hz), 1. 60–1. 68 (1H, m), 3. 39–3. 45 (4H, m), 4. 19 (1H, d, J=9. 9Hz), 4. 77 (2H, s), 6. 88 (1H, d, J=8. 7Hz), 7. 34–7. 93 (6H, m)
 FAB-MS (m/e) : 563 [M+H]⁺

実施例1091 (R¹:H; R²:H; R³:i-Pr; R⁴:H; Z:Ph; R:
 20 3-I-4-n-PrN(Me)COCH₂O-Ph)
¹HNMR (CDCl₃) δ : 0. 84 (3H, t, J=7. 3Hz), 0. 98 (3H, d, J=6. 7Hz), 1. 15 (3H, d, J=6. 7Hz), 1. 50–1. 69 (3H, m), 2. 96 (3H, s, rotomer), 3. 11 (3H, s, rotomer), 3. 37 (2H, t, J=7. 3Hz), 4. 80 (1H, d, J=10. 0Hz), 4. 79 (2H, s, rotomer), 4. 81 (2H, s, rotomer), 6. 87–7. 94 (7H, m, rotomer)
 FAB-MS (m/e) : 563 [M+H]⁺

実施例 1092 (R¹:H; R²:H; R³:i-Pr; R⁴:H; Z:Ph; R:
3-C1-4-n-Pr NHCOCH₂O-Ph)

¹HNMR (CDCl₃) δ: 0.93-0.98 (6H, m), 1.13 (3H, d, J=6.6Hz), 1.56-1.70 (3H, m), 3.34 (2H, d 5 t, J=6.6Hz), 4.21 (1H, d, J=9.8Hz), 4.54 (2 H, s), 6.80 (1H, br), 6.92 (1H, d, J=8.6Hz), 7.33-7.94 (6H, m)

ESI-MS (m/e) : 457 [M+H]⁺

10 実施例 1093 (R¹:H; R²:H; R³:i-Pr; R⁴:H; Z:Ph; R:
3-Br-4-n-Pr NHCOCH₂O-Ph)

¹HNMR (CDCl₃) δ: 0.97 (3H, t, J=7.8Hz), 0.97 (3H, d, J=6.6Hz), 1.13 (3H, d, J=6.6Hz), 1.56-1.69 (3H, m), 3.34 (2H, q, J=6.6Hz), 4.2 15 2 (1H, d, J=10.0Hz), 4.53 (2H, s), 6.87-6.89 (1H, m), 6.87 (1H, d, J=8.5Hz), 7.34-7.36 (1H, m), 7.45 (1H, d, J=8.5Hz), 7.60-7.63 (2 H, m), 7.72 (1H, s), 7.89-7.94 (1H, m)

FAB-MS (m/e) : 501/503 [M+H]⁺

20

実施例 1094 (R¹:H; R²:H; R³:i-Pr; R⁴:H; Z:Ph; R:
3-F-4-n-Pr NHCOCH₂O-Ph)

¹HNMR (CDCl₃) δ: 0.90-0.95 (6H, m), 1.12 (3H, d, J=6.6Hz), 1.54-1.70 (3H, m), 3.32 (2H, d 25 t, J=6.6Hz), 4.21 (1H, d, J=9.7Hz), 4.53 (2 H, s), 6.65 (1H, br), 6.94-7.93 (7H, m)

FAB-MS (m/e) : 441 [M+H]⁺

実施例 1095 (R¹:H; R²:H; R³:i-Pr; R⁴:H; Z:Ph; R:

3-Me-4-n-PrNHCOCH₂O-Ph)

¹HNMR (CDCl₃) δ : 0. 92 (3H, t, J=7. 6Hz), 0. 95
 (3H, d, J=6. 8Hz), 1. 11 (3H, d, J=6. 8Hz), 1.
 53-1. 74 (3H, m), 2. 28 (3H, s), 3. 33 (2H, q, J
 5 = 6. 6Hz), 4. 21 (1H, d, J=9. 9Hz), 4. 49 (2H, s),
 6. 51-6. 52 (1H, m), 6. 78 (1H, d, J=8. 2Hz), 7.
 29-7. 36 (3H, m), 7. 56-7. 62 (2H, m), 7. 88-7.
 92 (1H, m)

FAB-MS (m/e) : 437 [M+H]⁺

10

実施例1096 (R¹:H; R²:H; R³:i-Pr; R⁴:H; Z:Ph; R:
 4-EtNHCOCH₂O-3-F-Ph)

¹HNMR (CDCl₃) δ : 0. 94 (3H, d, J=6. 6Hz), 1. 13
 (3H, d, J=6. 6Hz), 1. 20 (3H, t, J=7. 3Hz), 1.
 15 6. 0-1. 68 (1H, m), 3. 41 (2H, dt, J=7. 3Hz), 4.
 21 (1H, d, J=9. 8Hz), 4. 53 (2H, s), 6. 63 (1H,
 br), 6. 95-7. 94 (7H, m)

ESI-MS (m/e) : 427 [M+H]⁺

20

実施例1097 (R¹:H; R²:H; R³:i-Pr; R⁴:H; Z:Ph; R:
 3-I-4-i-PrNHCOC(Me)₂CH₂O-Ph)

¹HNMR (CDCl₃) δ : 0. 91 (3H, t, J=7. 4Hz), 0. 96
 (3H, d, J=6. 7Hz), 1. 13 (3H, d, J=6. 7Hz), 1.
 52-1. 69 (3H, m), 3. 23 (2H, dt, J=5. 7Hz), 3.
 25 9. 3-3. 99 (2H, m), 4. 19 (1H, d, J=11. 0Hz), 6.
 27 (1H, br), 6. 77 (1Hd, J=8. 7Hz), 7. 32-7. 9
 2 (6H, m)

FAB-MS (m/e) : 427 [M+H]⁺

実施例 1098 (R¹:H; R²:H; R³:i-Pr; R⁴:H; Z:Ph; R:
3-Br-4-CH₂=CHCH₂NHCOCH₂O-Ph)

¹HNMR (CDCl₃) δ: 0. 94 (3H, t, J=6. 6Hz), 1. 13
(3H, d, J=6. 6Hz), 1. 60-1. 70 (1H, m), 4. 00-
5 4. 04 (2H, m), 4. 22 (1H, d, J=9. 7Hz), 4. 56 (2
H, s), 5. 18 (1H, d, J=10. 3Hz), 5. 24 (1H, d, J
=19. 7Hz), 5. 81-5. 96 (1H, m), 6. 88-6. 92 (1
H, m), 6. 89 (1H, d, J=8. 6Hz), 7. 33-7. 37 (1H,
m), 7. 45 (1H, dd, J=2. 3, 8. 6Hz), 7. 61-7. 65
10 (2H, m), 7. 72 (1H, d, J=2. 3Hz), 7. 90-7. 95 (1
H, m)

FAB-MS (m/e) : 499/501 [M+H]⁺

実施例 1099 (R¹:H; R²:H; R³:i-Pr; R⁴:H; Z:Ph; R:
4-i-BuNHCOCH₂O-3-F-Ph)

¹HNMR (CDCl₃) δ: 0. 90 (6H, d, J=6. 7Hz), 0. 93
(3H, d, J=6. 7Hz), 1. 12 (3H, d, J=6. 7Hz), 1.
59-1. 69 (1H, m), 1. 77-1. 84 (1H, m), 3. 18 (2
H, t, J=6. 7Hz), 4. 20 (1H, d, J=9. 7Hz), 4. 54
20 (2H, s), 6. 68 (1H, br), 6. 94-7. 93 (7H, m)

ESI-MS (m/e) : 455 [M+H]⁺

実施例 1100 (R¹:H; R²:H; R³:i-Pr; R⁴:H; Z:Ph; R:
3-t-BuO₂CCH=CH-4-n-PrNHCOCH₂O-Ph)

¹HNMR (CDCl₃) δ: 0. 88 (3H, t, J=7. 1Hz), 0. 92
(3H, d, J=6. 5Hz), 1. 12 (3H, d, J=6. 5Hz), 1.
41-1. 68 (3H, m), 1. 54 (9H, s), 3. 31 (2H, q, J
=6. 7Hz), 4. 22 (1H, d, J=9. 4Hz), 4. 57 (2H, s),
6. 39-6. 44 (1H, m), 6. 41 (1H, d, J=16. 2Hz),

6. 89 (1H, d, J=8. 5Hz), 7. 32-7. 34 (1H, m), 7. 45 (1H, dd, J=2. 3, 8. 5Hz), 7. 58-7. 64 (2H, m), 7. 67 (1H, d, J=2. 3Hz), 7. 86 (1H, d, J=16. 2Hz), 7. 93-7. 94 (1H, m)

5 FAB-MS (m/e) : 549 [M+H]⁺

実施例1101 (R¹:H; R²:H; R³:i-Pr; R⁴:H; Z:Ph; R:
3-HO₂CCH=CH-4-n-PrNHCOC₂O-Ph)

¹HNMR (CDCl₃) δ: 0. 91 (3H, t, J=7. 4Hz), 0. 93
10 (3H, d, J=6. 6Hz), 1. 12 (3H, d, J=6. 6Hz), 1.
53-1. 64 (3H, m), 3. 32 (2H, q, J=6. 7Hz), 4. 2
3 (1H, d, J=9. 8Hz), 4. 59 (2H, s), 6. 46-6. 48
(1H, m), 6. 51 (1H, d, J=16. 1Hz), 6. 92 (1H, d,
J=8. 7Hz), 7. 32-7. 35 (1H, m), 7. 50 (1H, dd,
15 J=2. 3, 8. 7Hz), 7. 59-7. 63 (2H, m), 7. 70 (1H,
d, J=2. 3Hz), 7. 92-7. 95 (1H, m), 8. 01 (1H, d,
J=16. 1Hz)

FAB-MS (m/e) : 493 [M+H]⁺

20 実施例1102 (R¹:H; R²:H; R³:i-Pr; R⁴:H; Z:Ph; R:
3-I-4-MeOCH₂CH₂NHCOC₂O-Ph)

¹HNMR (CDCl₃) δ: 0. 95 (3H, d, J=6. 7Hz), 1. 13
(3H, d, J=6. 7Hz), 1. 60-1. 70 (1H, m), 3. 38 (3
H, s), 3. 54-3. 60 (4H, m), 4. 21 (1H, d, J=9. 8
Hz), 4. 53 (2H, s), 6. 77 (1H, d, J=8. 6Hz), 7.
35-7. 94 (6H, m)

FAB-MS (m/e) : 565 [M+H]⁺

実施例1103 (R¹:H; R²:H; R³:i-Pr; R⁴:H; Z:Ph; R:

3-F-4-HO-Ph)

¹HNMR (CDCl₃) δ : 0. 95 (3H, d, J=6. 6Hz), 1. 13
 (3H, d, J=6. 6Hz), 1. 67-1. 74 (1H, m), 4. 21 (1
 H, d, J=9. 8Hz), 6. 91-7. 93 (7H, m)

5 FAB-MS (m/e) : 342 [M+H]⁺

実施例1104 (R¹:H; R²:H; R³:i-Pr; R⁴:H; Z:Ph; R:
 3-F-4-MeO-Ph)

¹HNMR (CDCl₃) δ : 0. 95 (3H, d, J=6. 7Hz), 1. 13
 10 (3H, d, J=6. 7Hz), 1. 63-1. 69 (1H, m), 3. 90 (3
 H, s), 4. 20 (1H, d, J=9. 8Hz), 6. 94-7. 92 (7H,
 m)

FAB-MS (m/e) : 356 [M+H]⁺

15 実施例1105 (R¹:H; R²:H; R³:i-Pr; R⁴:H; Z:Ph; R:
 3, 4-methylene dioxyPh)

¹HNMR (CDCl₃) δ : 0. 97 (3H, d, J=6. 7Hz), 1. 13
 (3H, d, J=6. 7Hz), 1. 65-1. 79 (1H, m), 4. 19 (1
 H, d, J=9. 9Hz), 5. 99 (1H, d, J=5. 5Hz), 6. 81
 20 (1H, d, J=8. 1Hz), 6. 86 (1H, d, J=1. 9Hz), 7.
 05 (1H, dd, J=1. 9, 8. 1Hz), 7. 33-7. 39 (1H, m),
 7. 57-7. 63 (2H, m), 7. 87-7. 93 (1H, m)

FAB-MS (m/e) : 352 [M+H]⁺

25 実施例1106 (R¹:H; R²:H; R³:i-Pr; R⁴:H; Z:Ph; R:
 3, 4-ethylene dioxyPh)

¹HNMR (CDCl₃) δ : 0. 97 (3H, d, J=6. 6Hz), 1. 13
 (3H, d, J=6. 6Hz), 1. 67-1. 72 (1H, m), 4. 18 (1
 H, d, J=10. 0Hz), 4. 26 (4H, s), 6. 85 (1H, d, J

=8. 4 Hz), 6. 94 (1H, dd, J=2. 2, 8. 4 Hz), 7. 00
 (1H, d, J=2. 2 Hz), 7. 35-7. 90 (4H, m)
 FAB-MS (m/e) : 366 [M+H]⁺

5 実施例1107 (R¹:H; R²:H; R³:i-Pr; R⁴:H; Z:Ph; R:
 3, 4-Cl₂-Ph)

¹HNMR (CDCl₃) δ: 0. 94 (3H, d, J=6. 5 Hz), 1. 13
 (3H, d, J=6. 5 Hz), 1. 53-1. 70 (1H, m), 4. 22 (1
 H, d, J=9. 4 Hz), 7. 29-7. 36 (2H, m), 7. 48 (1H,
 10 d, J=8. 1, Hz), 7. 59-7. 66 (3H, m), 7. 90-7. 9
 4 (1H, m)
 FAB-MS (m/e) : 376 [M+H]⁺

実施例1108 (R¹:H; R²:H; R³:i-Pr; R⁴:H; Z:Ph; R:
 15 3, 4-Me₂-Ph)

¹HNMR (CDCl₃) δ: 0. 95 (3H, d, J=6. 7 Hz), 1. 11
 (3H, d, J=6. 7 Hz), 1. 63-1. 71 (1H, m), 2. 25 (6
 H, s), 4. 18 (1H, d, J=10. 1 Hz), 7. 12-7. 92 (7
 H, m)

20 FAB-MS (m/e) : 336 [M+H]⁺

実施例1109 (R¹:H; R²:H; R³:i-Pr; R⁴:H; Z:Ph; R:
 3, 4-F₂-Ph)

¹HNMR (CDCl₃) δ: 0. 93 (3H, d, J=6. 6 Hz), 1. 13
 (3H, d, J=6. 6 Hz), 1. 64 (1H, m), 4. 22 (1H, d,
 J=9. 6 Hz), 7. 19-7. 35 (4H, m), 7. 61-7. 64 (2
 H, m), 7. 90-7. 94 (1H, m)
 FAB-MS (m/e) : 344 [M+H]⁺

実施例 1110 ($R^1: H; R^2: H; R^3: i-Pr; R^4: H; Z: Ph; R: 3, 4-(MeO)_2-Ph$)
 ESI-MS (m/e) : 368 [M+H]⁺

5 実施例 1111 ($R^1: H; R^2: H; R^3: i-Pr; R^4: H; Z: Ph; R: 3, 5-(MeO)_2-Ph$)
 ESI-MS (m/e) : 368 [M+H]⁺

10 実施例 1112 ($R^1: H; R^2: H; R^3: i-Pr; R^4: H; Z: Ph; R: 3, 5-Me_2-Ph$)
 ESI-MS (m/e) : 336 [M+H]⁺

15 実施例 1113 ($R^1: H; R^2: H; R^3: i-Pr; R^4: H; Z: Ph; R: 3, 5-I_2-4-HO-Ph$)
¹HNMR (CDCl₃) δ : 0. 98 (3H, d, J=6. 6Hz), 1. 15
 (3H, d, J=6. 6Hz), 1. 61-1. 72 (1H, m), 4. 20 (1
 H, d, J=9. 9Hz), 5. 79 (1H, brs), 7. 35-7. 94 (6
 H, m)
 FAB-MS (m/e) : 576 [M+H]⁺

20 実施例 1114 ($R^1: H; R^2: H; R^3: i-Pr; R^4: H; Z: Ph; R: 2, 4-I_2-5-HO-Ph$)
¹HNMR (CDCl₃) δ : 0. 95 (3H, d, J=6. 6Hz), 1. 14
 (3H, d, J=6. 6Hz), 1. 59-1. 66 (1H, m), 4. 26 (1
 H, d, J=9. 7Hz), 7. 21-7. 26 (1H, m), 7. 60-7.
 69 (2H, m), 7. 70 (1H, s), 7. 91-7. 95 (1H, m),
 8. 14 (1H, s)
 FAB-MS (m/e) : 576 [M+H]⁺

実施例 1115 ($R^1: H; R^2: H; R^3: i-Pr; R^4: H; Z: Ph; R: 3, 5-I_2-4-MeO-Ph$)

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) $\delta: 0.96$ (3H, d, $J=6.6\text{Hz}$), 1.13 (3H, d, $J=6.6\text{Hz}$), 1.61–1.72 (1H, m), 3.89+5.92 (3H, s+s, rotomer), 4.19 (1H, d, $J=9.8\text{Hz}$), 7.34–7.93 (6H, m)

FAB-MS (m/e) : 590 [M+H]⁺

実施例 1116 ($R^1: H; R^2: H; R^3: i-Pr; R^4: H; Z: Ph; R: 2, 4-I_2-5-MeO-Ph$)

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) $\delta: 0.94$ (3H, d, $J=7.1\text{Hz}$), 1.14 (3H, d, $J=7.1\text{Hz}$), 1.51–1.64 (1H, m), 3.99 (3H, s), 4.26 (1H, d, $J=9.5\text{Hz}$), 7.22–7.25 (1H, m), 7.45 (1H, s), 7.61–7.70 (2H, m), 7.93–7.15.95 (1H, m), 8.23 (1H, s)

FAB-MS (m/e) : 590 [M+H]⁺

実施例 1117 ($R^1: H; R^2: H; R^3: i-Pr; R^4: H; Z: Ph; R: 2, 4, 6-Me_3-Ph$)

ESI-MS (m/e) : 350 [M+H]⁺

実施例 1118 ($R^1: H; R^2: H; R^3: i-Pr; R^4: H; Z: Ph; R: 4-HO-(CH_2)_3-O-3, 5-I_2-Ph$)

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) $\delta: 0.99$ (3H, d, $J=6.6\text{Hz}$), 1.16 (3H, d, $J=6.6\text{Hz}$), 1.62–1.72 (1H, m), 2.17 (2H, dt, $J=5.7\text{Hz}$), 4.00 (2H, t, $J=5.7\text{Hz}$), 4.16 (2H, t, $J=5.7\text{Hz}$), 4.21 (1H, d, $J=9.9\text{Hz}$), 7.38–7.96 (6H, m)

FAB-MS (m/e) : 634 [M+H]⁺

実施例 1119 ($R^1: H; R^2: H; R^3: i-Pr; R^4: H; Z: Ph; R: 3, 5-I_2-4-n-PrNHCOCH_2O-Ph$)

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) $\delta: 0.97$ (3H, d, $J=6.7\text{Hz}$), 1.00 (3H, t, $J=7.4\text{Hz}$), 1.15 (3H, d, $J=6.7\text{Hz}$), 1.5 5.8-1.73 (3H, m), 3.38 (2H, q, $J=6.6\text{Hz}$), 4.21 (1H, d, $J=9.8\text{Hz}$), 4.49 (2H, s), 6.79-6.82 (1H, m), 7.38-7.40 (1H, m), 7.62-7.69 (2H, m), 7.90-7.95 (1H, m), 7.92 (2H, s)

FAB-MS (m/e) : 675 [M+H]⁺

10

実施例 1120 ($R^1: H; R^2: H; R^3: i-Pr; R^4: H; Z: Ph; R: 2-thienyl$)

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) $\delta: 1.04$ (3H, d, $J=6.6\text{Hz}$), 1.17 (3H, d, $J=6.6\text{Hz}$), 1.75-1.90 (1H, m), 4.18 (1H, d, $J=10.2\text{Hz}$), 7.02 (1H, dd, $J=3.6, 5.0\text{Hz}$), 7.26 (1H, dd, $J=1.1, 3.6\text{Hz}$), 7.35 (1H, dd, $J=1.1, 5.0\text{Hz}$), 7.45-7.55 (1H, m), 7.56-7.68 (2H, m), 7.89-7.92 (1H, m)

FAB-MS (m/e) : 314 [M+H]⁺

20

実施例 1121 ($R^1: H; R^2: H; R^3: i-Pr; R^4: H; Z: Ph; R: 2-furyl$)

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) $\delta: 1.01$ (3H, d, $J=6.6\text{Hz}$), 1.21 (3H, d, $J=6.6\text{Hz}$), 1.92-2.06 (1H, m), 4.17 (1H, d, $J=9.7\text{Hz}$), 6.39 (1H, dd, $J=1.8, 3.3\text{Hz}$), 6.40 (1H, d, $J=3.3\text{Hz}$), 7.43 (1H, d, $J=1.8\text{Hz}$), 7.58-7.70 (3H, m), 7.88-7.98 (1H, m)

FAB-MS (m/e) : 298 [M+H]⁺

実施例 1122 (R¹:H; R²:H; R³:i-Pr; R⁴:H; Z:Ph; R:
3-pyridyl)

¹HNMR (CDCl₃) δ: 0.92 (3H, d, J=6.7Hz), 1.12
(3H, d, J=6.7Hz), 1.55-1.70 (1H, m), 4.24 (1
5 H, d, J=9.6Hz), 7.32-7.40 (2H, m), 7.60-7.
65 (2H, m), 7.79-7.83 (1H, m), 7.92-7.96 (1
H, m), 8.66 (1H, d, J=4.6Hz), 8.78 (1H, brs)
FAB-MS (m/e) : 309 [M+H]⁺

10 実施例 1123 (R¹:H; R²:H; R³:i-Pr; R⁴:H; Z:Ph; R:
2-naphthyl)
ESI-MS (m/e) : 358 [M+H]⁺

15 実施例 1124 (R¹:H; R²:H; R³:i-Pr; R⁴:H; Z:Ph; R:
5-F-1-naphthyl)
ESI-MS (m/e) : 376 [M+H]⁺

20 実施例 1125 (R¹:H; R²:H; R³:i-Pr; R⁴:H; Z:Ph; R:
dibenzothiophene-2-y1)
ESI-MS (m/e) : 414 [M+H]⁺

実施例 1126 (R¹:6-F; R²:H; R³:i-Pr; R⁴:H; Z:Ph;
R:Ph)

25 ¹HNMR (CDCl₃) δ: 0.91 (3H, d, J=6.6Hz), 1.10
(3H, d, J=6.7Hz), 1.52-1.67 (1H, m), 4.22 (1
H, d, J=9.8Hz), 7.13 (1H, d, J=7.8Hz), 7.22
(1H, dd, J=8.5, 8.6Hz), 7.38-7.43 (3H, m),
7.47-7.51 (2H, m), 7.57 (1H, ddd, J=4.7, 7.
8, 8.5Hz)

FAB-MS (m/e) : 326 [M+H]⁺

実施例 1127 (R¹: 7-F; R²: H; R³: i-Pr; R⁴: H; Z: Ph; R: Ph)

- 5 ¹HNMR (CDCl₃) δ: 0.89 (3H, d, J=6.6Hz), 1.10
 (3H, d, J=6.6Hz), 1.64 (1H, m), 4.20 (1H, d,
 J=9.8Hz), 7.23-7.33 (2H, m), 7.35-7.51 (5
 H, m), 7.54-7.58 (1H, m)

FAB-MS (m/e) : 326 [M+H]⁺

10

実施例 1128 (R¹: 8-F; R²: H; R³: i-Pr; R⁴: H; Z: Ph; R: Ph)

- ¹HNMR (CDCl₃) δ: 0.92 (3H, d, J=6.6Hz), 1.12
 (3H, d, J=6.6Hz), 1.61-1.65 (1H, m), 4.20 (1
 H, d, J=9.8Hz), 6.98-7.00 (1H, m), 7.22-7.
 31 (1H, m), 7.38-7.49 (5H, m), 7.90 (1H, dd,
 J=7.6, 11.1Hz)

FAB-MS (m/e) : 326 [M+H]⁺

20 実施例 1129 (R¹: 9-F; R²: H; R³: i-Pr; R⁴: H; Z: Ph; R: Ph)

- ¹HNMR (CDCl₃) δ: 0.89 (3H, d, J=6.6Hz), 1.10
 (3H, d, J=6.7Hz), 1.53-1.64 (1H, m), 4.19 (1
 H, d, J=9.8Hz), 7.24 (1H, dd, J=7.8, 8.6Hz),
 7.37-7.41 (3H, m), 7.50-7.54 (2H, m), 7.61
 (1H, ddd, J=4.3, 7.8, 7.8Hz), 7.73 (1H, d, J
 =7.8Hz)

FAB-MS (m/e) : 326 [M+H]⁺

実施例 1130 (R¹: 6-MeO; R²: H; R³: i-Pr; R⁴: H; Z: Ph; R: Ph)

¹HNMR (CDCl₃) δ: 0.88 (3H, d, J=6.7Hz), 1.09
 (3H, d, J=6.7Hz), 1.58-1.68 (1H, m), 4.01 (3
 5 H, s), 4.21 (1H, d, J=9.7Hz), 6.88 (1H, d, J=
 7.3Hz), 7.33-7.60 (6H, m)
 FAB-MS (m/e) : 338 [M+H]⁺

実施例 1131 (R¹: 9-MeO; R²: H; R³: i-Pr; R⁴: H; Z:
 10 Ph; R: Ph)

¹HNMR (CDCl₃) δ: 0.85 (3H, d, J=6.6Hz), 1.08
 (3H, d, J=6.6Hz), 1.52-1.59 (1H, m), 3.69 (3
 H, s), 4.15 (1H, d, J=9.7Hz), 7.03 (1H, dd, 1.
 0, 8.0Hz), 7.31-7.35 (3H, m), 7.46-7.59 (3
 15 H, m), 7.55 (1H, d, J=7.8Hz)
 FAB-MS (m/e) : 338 [M+H]⁺

実施例 1132 (R¹: 6-OH; R²: H; R³: i-Pr; R⁴: H; Z: Ph;
 R: Ph)

²⁰ ¹HNMR (CDCl₃) δ: 0.90 (3H, d, J=6.7Hz), 1.10
 (3H, d, J=6.7Hz), 1.52-1.70 (1H, m), 4.15 (1
 H, d, J=9.7Hz), 6.83 (1H, d, 7.6Hz), 7.00 (1
 H, d, J=8.3Hz), 7.34-7.51 (6H, m), 8.03 (1H,
 brs)
²⁵ FAB-MS (m/e) : 324 [M+H]⁺

実施例 1133 (R¹: 9-OH; R²: H; R³: i-Pr; R⁴: H; Z: Ph;
 R: Ph)

¹HNMR (CDCl₃) δ: 0.79 (3H, d, J=6.7Hz), 1.06

(3H, d, J=6. 7Hz), 1. 60-1. 67 (1H, m), 4. 17 (1H, d, J=9. 5Hz), 7. 11 (1H, dd, J=1. 0, 8. 2Hz), 7. 41-7. 64 (7H, m), 9. 31 (1H, brs)
 FAB-MS (m/e) : 324 [M+H]⁺

5

実施例1134 (R¹: 7-NO₂; R²: H; R³: i-Pr; R⁴: H; Z: Ph; R: Ph)
¹HNMR (CDCl₃) δ: 0. 93 (3H, d, J=6. 6Hz), 1. 12
 (3H, d, J=6. 6Hz), 1. 58-1. 68 (1H, m), 4. 25 (1H, d, J=9. 9Hz), 7. 41-7. 55 (5H, m), 8. 45 (1H, dd, J=2. 2, 8. 4Hz), 8. 74 (1H, d, J=2. 2Hz)
 FAB-MS (m/e) : 353 [M+H]⁺

実施例1135 (R¹: 8-NO₂; R²: H; R³: i-Pr; R⁴: H; Z: Ph; R: Ph)
¹HNMR (CDCl₃) δ: 0. 93 (3H, d, J=6. 7Hz), 1. 12
 (3H, d, J=6. 7Hz), 1. 58-1. 68 (1H, m), 4. 25 (1H, d, J=10. 0Hz), 7. 42-7. 55 (5H, m), 8. 09 (1H, d, J=8. 3Hz), 8. 16 (1H, d, J=1. 8Hz), 8. 46 (1H, dd, J=1. 8, 8. 3Hz)
 FAB-MS (m/e) : 353 [M+H]⁺

実施例1136 (R¹: 9-NO₂; R²: H; R³: i-Pr; R⁴: H; Z: Ph; R: Ph)
¹HNMR (CDCl₃) δ: 0. 76 (3H, d, J=6. 7Hz), 1. 10
 (3H, d, J=6. 7Hz), 1. 45-1. 59 (1H, m), 4. 19 (1H, d, J=10. 0Hz), 7. 26-7. 38 (5H, m), 7. 89 (1H, dd, J=7. 6, 8. 1Hz), 8. 30 (1H, dd, J=0. 9, 7. 6Hz), 8. 40 (1H, dd, J=0. 9, 8. 1Hz)

FAB-MS (m/e) : 353 [M+H]⁺

実施例1137 (R¹: 6-NHPh; R²: H; R³: i-Pr; R⁴: H; Z: Ph; R: Ph)

- 5 ¹HNMR (CDCl₃) δ: 0.79 (3H, d, J=6.7Hz), 1.11
 (3H, d, J=6.6Hz), 1.50-1.56 (1H, m), 4.20 (1
 H, d, J=9.5Hz), 5.55 (1H, s), 6.79-6.81 (2H,
 m), 6.99-7.01 (1H, m), 7.19-7.27 (2H, m), 7.
 28-7.37 (2H, m), 7.39-7.44 (4H, m), 7.46-7.
 10 52 (2H, m)

FAB-MS (m/e) : 399 [M+H]⁺

実施例1138 (R¹: 7-Me₂N; R²: H; R³: i-Pr; R⁴: H; Z: Ph; R: Ph)

- 15 ¹HNMR (CDCl₃) δ: 0.91 (3H, d, J=6.6Hz), 1.10
 (3H, d, J=6.6Hz), 1.55-1.66 (1H, m), 3.03 (6
 H, s), 4.19 (1H, d, J=9.9Hz), 6.84 (1H, dd, J
 =2.5, 8.6Hz), 7.08-7.50 (7H, m)
- FAB-MS (m/e) : 351 [M+H]⁺

20

実施例1139 (R¹: 7-Me; R²: H; R³: i-Pr; R⁴: H; Z: Ph; R: Ph)

- 1¹HNMR (CDCl₃) δ: 0.91 (3H, d, J=6.6Hz), 1.10
 (3H, d, J=6.6Hz), 1.55-1.65 (1H, m), 2.45 (3
 25 H, s), 4.20 (1H, d, J=9.8Hz), 7.21 (1H, d, J
 =7.9Hz), 7.35-7.42 (4H, m), 7.45-7.50 (2H,
 m), 7.70 (1H, d, J=0.7Hz)

FAB-MS (m/e) : 322 [M+H]⁺

実施例 1140 (R^1 : 8-Me; R^2 : H; R^3 : i-Pr; R^4 : H; Z: Ph; R: Ph)

^1H NMR (CDCl₃) δ : 0.91 (3H, d, J=6.6 Hz), 1.09 (3H, d, J=6.6 Hz), 1.55-1.68 (1H, m), 2.38 (3H, s), 4.19 (1H, d, J=9.8 Hz), 7.11 (1H, s), 7.35-7.45 (4H, m), 7.45-7.52 (2H, m), 7.79 (1H, d, J=7.6 Hz)

FAB-MS (m/e) : 322 [M+H]⁺

10 実施例 1141 (R^1 : 7-t-Bu; R^2 : H; R^3 : i-Pr; R^4 : H; Z: Ph; R: Ph)

^1H NMR (CDCl₃) δ : 0.92 (3H, d, J=6.7 Hz), 1.10 (3H, d, J=6.7 Hz), 1.35 (9H, s), 1.63-1.67 (1H, m), 4.20 (1H, d, J=9.9 Hz), 7.26 (1H, d, J=8.4 Hz), 7.37-7.52 (5H, m), 7.62 (1H, dd, J=1.5, 8.4 Hz), 7.92 (1H, d, J=1.5 Hz)

FAB-MS (m/e) : 364 [M+H]⁺

20 実施例 1142 (R^1 : 8-t-Bu; R^2 : H; R^3 : i-Pr; R^4 : H; Z: Ph; R: Ph)

^1H NMR (CDCl₃) δ : 0.92 (3H, d, J=6.7 Hz), 1.10 (3H, d, J=6.7 Hz), 1.27 (9H, s), 1.60-1.65 (1H, m), 4.19 (1H, d, J=9.9 Hz), 7.30 (1H, d, J=1.6 Hz), 7.37-7.52 (5H, m), 7.61 (1H, dd, J=1.6, 8.1 Hz), 7.83 (1H, d, J=8.1 Hz)

FAB-MS (m/e) : 364 [M+H]⁺

実施例 1143 (R^1 : 7-Br; R^2 : H; R^3 : i-Pr; R^4 : H; Z: Ph; R: Ph)

¹HNMR (CDCl₃) δ : 0. 91 (3H, d, J=6. 6Hz), 1. 09 (3H, d, J=6. 65Hz), 1. 58-1. 65 (1H, m), 4. 20 (1H, d, J=9. 8Hz), 7. 40-7. 50 (6H, m), 7. 70-7. 79 (2H, m)

5 FAB-MS (m/e) : 386/388 [M+H]⁺

実施例1144 (R¹:8-Br; R²:H; R³:i-Pr; R⁴:H; Z:Ph; R:Ph)

10 ¹HNMR (CDCl₃) δ : 0. 91 (3H, d, J=6. 7Hz), 1. 10 (3H, d, J=6. 7Hz), 1. 61-1. 63 (1H, m), 4. 20 (1H, d, J=9. 8Hz), 7. 21 (1H, d, J=8. 5Hz), 7. 38-7. 49 (5H, m), 7. 70 (1H, dd, J=1. 9, 8. 1Hz), 8. 03-8. 04 (1H, m)

FAB-MS (m/e) : 386/388 [M+H]⁺

15

実施例1145 (R¹:7-Cl; R²:H; R³:i-Pr; R⁴:H; Z:Ph; R:Ph)

20 ¹HNMR (CDCl₃) δ : 0. 91 (3H, d, J=6. 6Hz), 1. 10 (3H, d, J=6. 6Hz), 1. 56-1. 68 (1H, m), 4. 21 (1H, d, J=9. 8Hz), 7. 27 (1H, dd, J=0. 6, 8. 2Hz), 7. 37-7. 43 (3H, m), 7. 44-7. 51 (2H, m), 7. 55 (1H, dd, J=1. 9, 8. 2Hz), 7. 87 (1H, dd, J=0. 6, 1. 9Hz)

FAB-MS (m/e) : 342 [M+H]⁺

25

実施例1146 (R¹:8-Cl; R²:H; R³:i-Pr; R⁴:H; Z:Ph; R:Ph)

¹HNMR (CDCl₃) δ : 0. 91 (3H, d, J=6. 6Hz), 1. 10 (3H, d, J=6. 7Hz), 1. 53-1. 72 (1H, m), 4. 20 (1

H, d, J=9. 8 Hz), 7. 31 (1H, dd, J=0. 6, 1. 7 Hz),
 7. 39-7. 48 (5H, m), 7. 56 (1H, dd, J=1. 7, 8. 1
 Hz), 7. 84 (1H, dd, J=0. 6, 8. 1 Hz)
 FAB-MS (m/e) : 342 [M+H] +

5

実施例1147 (R¹: 7-C1; R²: 8-C1; R³: i-Pr; R⁴: H;
 Z: Ph; R: Ph)

¹HNMR (CDCl₃) δ: 0. 90 (3H, d, J=6. 6 Hz), 1. 09
 (3H, d, J=6. 6 Hz), 1. 60-1. 64 (1H, m), 4. 19 (1
 10 H, d, J=9. 9 Hz), 7. 40-7. 48 (6H, m), 7. 98 (1H,
 s)

FAB-MS (m/e) : 376 [M+H] +

実施例1148 (R¹: 6-C1; R²: 9-C1; R³: i-Pr; R⁴: H;
 15 Z: Ph; R: Ph)

¹HNMR (CDCl₃) δ: 0. 76 (3H, d, J=6. 6 Hz), 1. 09
 (3H, d, J=6. 6 Hz), 1. 49-1. 59 (1H, m), 4. 19 (1
 H, d, J=9. 6 Hz), 7. 36-7. 48 (6H, m), 7. 52 (1H,
 d, J=8. 4 Hz)

20 FAB-MS (m/e) : 376 [M+H] +

実施例1149 (R¹: 6-OH; R²: 9-I; R³: i-Pr; R⁴: H; Z:
 Ph; R: Ph)

¹HNMR (DMSO-d₆) δ: 0. 64 (3H, d, J=6. 7 Hz), 0.
 25 9. 6 (3H, d, J=6. 7 Hz), 1. 40-1. 52 (1H, m), 4. 1
 9 (1H, d, J=8. 9 Hz), 6. 82 (1H, d, J=8. 5 Hz), 7.
 30-7. 40 (5H, m), 7. 85 (1H, d, J=8. 5 Hz), 10.
 56 (1H, br s)

FAB-MS (m/e) : 450 [M+H] +

実施例 1150 (R¹:H; R²:H; R³:i-Pr; R⁴:H; Z:1, 2-naphthyl; R:Ph)

¹HNMR (CDCl₃) δ: 0.80 (3H, d, J=6.5Hz), 1.13 (3H, d, J=6.5Hz), 1.55-1.70 (1H, m), 4.21 (1H, d, J=9.1Hz), 7.30-7.40 (3H, m), 7.40-7.50 (3H, m), 7.54-7.60 (1H, m), 7.80 (1H, d, J=8.6Hz), 7.93 (1H, d, J=8.2Hz), 7.94 (1H, d, J=8.2Hz), 8.08 (1H, d, J=8.2Hz)
FAB-MS (m/e) : 358 [M+H]⁺

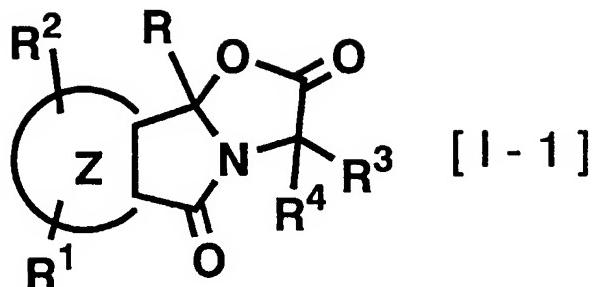
10

実施例 1151 (R¹:H; R²:H; R³:i-Pr; R⁴:H; Z:2, 3-naphthyl; R:Ph)

¹HNMR (CDCl₃) δ: 0.96 (3H, d, J=6.1Hz), 1.13 (3H, d, J=6.1Hz), 1.59-1.67 (1H, m), 4.28 (1H, d, J=10.1Hz), 7.34-7.43 (3H, m), 7.54-7.76 (4H, m), 7.76 (1H, s), 7.83-7.85 (1H, m), 8.04-8.06 (1H, m), 8.54 (1H, s)
FAB-MS (m/e) : 358 [M+H]⁺

20 実施例 1152 (R¹:H; R²:H; R³:i-Pr; R⁴:H; Z:cyclohexenyl; R:Ph)

¹HNMR (CDCl₃) δ: 0.79 (3H, d, J=6.0Hz), 1.04 (3H, d, J=6.0Hz), 1.56-1.80 (5H, m), 2.28-2.30 (4H, m), 4.04 (1H, d, J=9.0Hz), 7.391-7.394 (5H, m)
FAB-MS (m/e) : 312 [M+H]⁺



但し、R³は由来するアミノ酸を示す。

実施例 1153 (R¹:H; R²:H; R³:D-Leucine; R⁴:H; Z:
5 Ph; R:Ph)
ESI-MS (m/e) : 322 [M+H]⁺

実施例 1154 (R¹:H; R²:H; R³:L-Leucine; R⁴:H; Z:
Ph; R:Ph)
10 ESI-MS (m/e) : 322 [M+H]⁺

実施例 1155 (R¹:H; R²:H; R³:D-NorLeucine; R⁴:
H; Z:Ph; R:Ph)
ESI-MS (m/e) : 322 [M+H]⁺

15 実施例 1156 (R¹:H; R²:H; R³:L-NorLeucine; R⁴:
H; Z:Ph; R:Ph)
ESI-MS (m/e) : 322 [M+H]⁺

20 実施例 1157 (R¹:H; R²:H; R³:D-AlloLeucine; R⁴:
H; Z:Ph; R:Ph)
ESI-MS (m/e) : 322 [M+H]⁺

実施例 1158 (R¹:H; R²:H; R³:L-AlloLeucine; R⁴:

H ; Z : Ph ; R : Ph)

ESI-MS (m/e) : 322 [M+H] +

実施例 1159 (R¹:H; R²:H; R³:D-NorValine; R⁴:H;
5 Z : Ph ; R : Ph)

ESI-MS (m/e) : 308 [M+H] +

実施例 1160 (R¹:H; R²:H; R³:L-NorValine; R⁴:H;
Z : Ph ; R : Ph)

10 ESI-MS (m/e) : 308 [M+H] +

実施例 1161 (R¹:H; R²:H; R³:D-Alanine; R⁴:H; Z :
Ph ; R : Ph)

ESI-MS (m/e) : 280 [M+H] +

15

実施例 1162 (R¹:H; R²:H; R³:L-Alanine; R⁴:H; Z :
Ph ; R : Ph)

ESI-MS (m/e) : 280 [M+H] +

20 実施例 1163 (R¹:H; R²:H; R³:D-Arginine; R⁴:H;
Z : Ph ; R : Ph)

ESI-MS (m/e) : 365 [M+H] +

実施例 1164 (R¹:H; R²:H; R³:L-Arginine; R⁴:H;
25 Z : Ph ; R : Ph)

ESI-MS (m/e) : 365 [M+H] +

実施例 1165 (R¹:H; R²:H; R³:D-Asparagine; R⁴:
H ; Z : Ph ; R : Ph)

E S I - M S (m/e) : 3 2 3 [M+H] +

実施例 1 1 6 6 (R¹:H; R²:H; R³:L-Asparagine; R⁴:H; Z:Ph; R:Ph)

5 E S I - M S (m/e) : 3 2 3 [M+H] +

実施例 1 1 6 7 (R¹:H; R²:H; R³:L-Glutamic Acid; R⁴:H; Z:Ph; R:Ph)

E S I - M S (m/e) : 3 3 8 [M+H] +

10

実施例 1 1 6 8 (R¹:H; R²:H; R³:L-Glutamic Acid; R⁴:H; Z:Ph; R:Ph)

E S I - M S (m/e) : 3 3 8 [M+H] +

15

実施例 1 1 6 9 (R¹:H; R²:H; R³:D-Glutamine; R⁴:H; Z:Ph; R:Ph)

E S I - M S (m/e) : 3 3 7 [M+H] +

20

実施例 1 1 7 0 (R¹:H; R²:H; R³:L-Glutamine; R⁴:H;

Z:Ph; R:Ph)

E S I - M S (m/e) : 3 3 7 [M+H] +

25

実施例 1 1 7 1 (R¹:H; R²:H; R³:D-Histidine; R⁴:H; Z:Ph; R:Ph)

E S I - M S (m/e) : 3 4 6 [M+H] +

実施例 1 1 7 2 (R¹:H; R²:H; R³:L-Histidine; R⁴:H; Z:Ph; R:Ph)

E S I - M S (m/e) : 3 4 6 [M+H] +

実施例 1173 ($R^1 : H ; R^2 : H ; R^3 : D\text{-Methionine} ; R^4 : H ; Z : Ph ; R : Ph$)
 ESI-MS (m/e) : 340 [M+H]⁺

5 実施例 1174 ($R^1 : H ; R^2 : H ; R^3 : L\text{-Methionine} ; R^4 : H ; Z : Ph ; R : Ph$)
 ESI-MS (m/e) : 340 [M+H]⁺

10 実施例 1175 ($R^1 : H ; R^2 : H ; R^3 : D\text{-Tryptophan} ; R^4 : H ; Z : Ph ; R : Ph$)
 ESI-MS (m/e) : 395 [M+H]⁺

15 実施例 1176 ($R^1 : H ; R^2 : H ; R^3 : L\text{-Tryptophan} ; R^4 : H ; Z : Ph ; R : Ph$)
 ESI-MS (m/e) : 395 [M+H]⁺

20 実施例 1177 ($R^1 : H ; R^2 : H ; R^3 : D\text{-Tyrosine} ; R^4 : H ; Z : Ph ; R : Ph$)
 ESI-MS (m/e) : 372 [M+H]⁺

実施例 1178 ($R^1 : H ; R^2 : H ; R^3 : L\text{-Tyrosine} ; R^4 : H ; Z : Ph ; R : Ph$)
¹HNMR (CDCl₃) δ : 2.45 (1H, dd, J=11.5, 14.5 Hz), 3.07 (1H, dd, J=4.4, 14.5 Hz), 4.92 (1H, dd, J=4.4, 11.5 Hz), 5.31 (1H, brs), 6.77 (2H, d, J=8.6 Hz), 6.99 (2H, d, J=8.6 Hz), 7.34–7.37 (1H, m), 7.39–7.44 (3H, m), 7.46–7.50 (2H, m), 7.55–7.59 (2H, m), 7.84–7.87 (1H, m)

FAB-MS (m/e) : 372 [M+H] ⁺

実施例 1179 (R¹:H; R²:H; R³:D-HomoPhenylala
nine; R⁴:H; Z:Ph; R:Ph)

5 ESI-MS (m/e) : 370 [M+H] ⁺

実施例 1180 (R¹:H; R²:H; R³:L-HomoPhenylala
nine; R⁴:H; Z:Ph; R:Ph)

ESI-MS (m/e) : 370 [M+H] ⁺

10

実施例 1181 (R¹:H; R²:H; R³:D-Leucine; R⁴:H; Z:
Ph; R:4-C1-Ph)

ESI-MS (m/e) : 356 [M+H] ⁺

15

実施例 1182 (R¹:H; R²:H; R³:L-Leucine; R⁴:H; Z:
Ph; R:4-C1-Ph)

ESI-MS (m/e) : 356 [M+H] ⁺

20

実施例 1183 (R¹:H; R²:H; R³:D-NorLeucine; R⁴:
H; Z:Ph; R:4-C1-Ph)

ESI-MS (m/e) : 356 [M+H] ⁺

25

実施例 1184 (R¹:H; R²:H; R³:L-NorLeucine; R⁴:
H; Z:Ph; R:4-C1-Ph)

ESI-MS (m/e) : 356 [M+H] ⁺

実施例 1185 (R¹:H; R²:H; R³:D-AlloLeucine; R⁴:
H; Z:Ph; R:4-C1-Ph)

ESI-MS (m/e) : 356 [M+H] ⁺

実施例1186 ($R^1: H; R^2: H; R^3: L\text{-AlloLeucine}; R^4: H; Z: Ph; R: 4\text{-Cl-Ph}$)
 ESI-MS (m/e) : 356 [M+H]⁺

5 実施例1187 ($R^1: H; R^2: H; R^3: D\text{-NorValine}; R^4: H; Z: Ph; R: 4\text{-Cl-Ph}$)
 ESI-MS (m/e) : 342 [M+H]⁺

10 実施例1188 ($R^1: H; R^2: H; R^3: L\text{-NorValine}; R^4: H; Z: Ph; R: 4\text{-Cl-Ph}$)
 ESI-MS (m/e) : 342 [M+H]⁺

15 実施例1189 ($R^1: H; R^2: H; R^3: D\text{-Alanine}; R^4: H; Z: Ph; R: 4\text{-Cl-Ph}$)
 ESI-MS (m/e) : 314 [M+H]⁺

20 実施例1190 ($R^1: H; R^2: H; R^3: L\text{-Alanine}; R^4: H; Z: Ph; R: 4\text{-Cl-Ph}$)
 ESI-MS (m/e) : 314 [M+H]⁺

25 実施例1191 ($R^1: H; R^2: H; R^3: D\text{-Arginine}; R^4: H; Z: Ph; R: 4\text{-Cl-Ph}$)
 ESI-MS (m/e) : 399 [M+H]⁺

30 実施例1192 ($R^1: H; R^2: H; R^3: L\text{-Arginine}; R^4: H; Z: Ph; R: 4\text{-Cl-Ph}$)
 ESI-MS (m/e) : 399 [M+H]⁺

実施例1193 ($R^1: H; R^2: H; R^3: D\text{-Asparagine}; R^4:$

H ; Z : Ph ; R : 4 - C1 - Ph)
ESI-MS (m/e) : 357 [M+H] +

実施例 1194 (R¹ : H ; R² : H ; R³ : L - Asparagine ; R⁴ :
5 H ; Z : Ph ; R : 4 - C1 - Ph)
ESI-MS (m/e) : 357 [M+H] +

実施例 1195 (R¹ : H ; R² : H ; R³ : D - Glutamic Acid ;
R⁴ : H ; Z : Ph ; R : 4 - C1 - Ph)
10 ESI-MS (m/e) : 372 [M+H] +

実施例 1196 (R¹ : H ; R² : H ; R³ : L - Glutamic Acid ;
R⁴ : H ; Z : Ph ; R : 4 - C1 - Ph)
ESI-MS (m/e) : 372 [M+H] +

15 実施例 1197 (R¹ : H ; R² : H ; R³ : D - Glutamine ; R⁴ : H ;
Z : Ph ; R : 4 - C1 - Ph)
ESI-MS (m/e) : 371 [M+H] +

20 実施例 1198 (R¹ : H ; R² : H ; R³ : L - Glutamine ; R⁴ : H ;
Z : Ph ; R : 4 - C1 - Ph)
ESI-MS (m/e) : 371 [M+H] +

25 実施例 1199 (R¹ : H ; R² : H ; R³ : D - Histidine ; R⁴ : H ;
Z : Ph ; R : 4 - C1 - Ph)
ESI-MS (m/e) : 380 [M+H] +

実施例 1200 (R¹ : H ; R² : H ; R³ : L - Histidine ; R⁴ : H ;
Z : Ph ; R : 4 - C1 - Ph)

E S I - M S (m/e) : 380 [M+H] +

実施例 1201 (R¹:H; R²:H; R³:D-Methionine; R⁴:H; Z:Ph; R:4-C1-Ph)

5 E S I - M S (m/e) : 374 [M+H] +

実施例 1202 (R¹:H; R²:H; R³:L-Methionine; R⁴:H; Z:Ph; R:4-C1-Ph)

E S I - M S (m/e) : 374 [M+H] +

10

実施例 1203 (R¹:H; R²:H; R³:D-Tryptophan; R⁴:H; Z:Ph; R:4-C1-Ph)

E S I - M S (m/e) : 429 [M+H] +

15

実施例 1204 (R¹:H; R²:H; R³:L-Tryptophan; R⁴:H; Z:Ph; R:4-C1-Ph)

E S I - M S (m/e) : 429 [M+H] +

20

実施例 1205 (R¹:H; R²:H; R³:D-Tyrosine; R⁴:H;

Z:Ph; R:4-C1-Ph)

E S I - M S (m/e) : 406 [M+H] +

25

実施例 1206 (R¹:H; R²:H; R³:L-Tyrosine; R⁴:H; Z:Ph; R:4-C1-Ph)

E S I - M S (m/e) : 406 [M+H] +

実施例 1207 (R¹:H; R²:H; R³:D-Homophenylalanine; R⁴:H; Z:Ph; R:4-C1-Ph)

E S I - M S (m/e) : 404 [M+H] +

実施例1208 (R^1 :H; R^2 :H; R^3 :L-HomoPhenylala
nine; R^4 :H; Z:Ph; R:4-C1-Ph)
ESI-MS (m/e) : 404 [M+H]⁺

- 5 実施例1209 (R^1 :H; R^2 :H; R^3 :t-Bu; R^4 :H; Z:Ph; R:
Ph)
¹HNMR (CDCl₃) δ: 0.90 (9H, s), 4.29 (1H, s), 7.
30 (1H, ddd, J=0.8, 3.2, 5.6Hz), 7.34-7.41
(3H, m), 7.42-7.44 (2H, m), 7.54-7.59 (2H,
10. m), 7.91 (1H, ddd, J=0.8, 3.2, 5.6Hz)
ESI-MS (m/e) : 322 [M+H]⁺

- 実施例1210 (R^1 :H; R^2 :H; R^3 :Me₂(OH)C; R^4 :H; Z:
Ph; R:Ph)
15 ¹HNMR (CDCl₃) δ: 1.30 (3H, s), 1.45 (3H, s), 4.
43 (1H, s), 7.33-7.64 (8H, m), 7.93 (1H, dd,
J=6.0, 2.6Hz)
FAB-MS (m/e) : 324 [M+H]⁺
- 20 実施例1211 (R^1 :H; R^2 :H; R^3 :Me(MeO)CH; R^4 :H; Z:
Ph; R:Ph)
¹HNMR (CDCl₃) δ: 1.54 (3H, d, J=6.1Hz), 3.66
(3H, s), 4.33 (1H, d, J=7.3Hz), 4.54 (1H, dt,
J=6.1, 7.3Hz), 7.27-7.84 (9H, m)
25 FAB-MS (m/e) : 324 [M+H]⁺

実施例1212 (R^1 :H; R^2 :H; R^3 :4-HO-Ph; R^4 :H; Z:Ph;
R:Ph)
¹HNMR (CDCl₃) δ: 4.95 (1H, brs), 5.73 (1H, s),

6. 59 (2H, d, J=8. 4Hz), 7. 05 (2H, d, J=8. 4Hz),
 7. 22-7. 43 (6H, m), 7. 60-7. 68 (2H, m), 7. 96-
 7. 98 (1H, m)

FAB-MS (m/e) : 358 [M+H]⁺

5

実施例1213 (R¹:H; R²:H; R³:4-HO-3-I-Ph; R⁴:H;
 Z:Ph; R:Ph)

¹HNMR (CDCl₃) δ: 5. 38 (1H, br s), 5. 68 (1H, s),
 6. 76 (1H, d, J=8. 5Hz), 7. 14 (1H, dd, J=2. 2,
 10 8. 5Hz), 7. 30-7. 45 (7H, m), 7. 62-7. 70 (2H,
 m), 7. 96-8. 00 (1H, m)

FAB-MS (m/e) : 484 [M+H]⁺

実施例1214 (R¹:H; R²:H; R³:4-HO-3, 5-I₂-Ph; R
 15 4:H; Z:Ph; R:Ph)

¹HNMR (CDCl₃) δ: 5. 62 (1H, s), 7. 30-7. 48 (8H,
 m), 7. 62-7. 80 (2H, m), 7. 97-8. 01 (1H, m)

FAB-MS (m/e) : 610 [M+H]⁺

20 実施例1215 (R¹:H; R²:H; R³:4-HO-3-I-PhCH₂; R
 4:H; Z:Ph; R:Ph)

¹HNMR (CDCl₃) δ: 2. 45 (1H, dd, J=9. 8, 14. 5Hz),
 3. 02 (1H, dd, J=5. 2, 14. 5Hz), 4. 84 (1H, dd,
 J=5. 2, 9. 8Hz), 5. 61 (1H, br s), 7. 29-7. 40 (5

25 H, m), 7. 42-7. 43 (3H, m), 7. 57-7. 61 (2H, m),
 7. 86-7. 90 (1H, m)

FAB-MS (m/e) : 624 [M+H]⁺

実施例1216 (R¹:H; R²:H; R³:4-HO-3, 5-I₂-PhCH

$_z ; R^4 : H ; Z : Ph ; R : Ph$)

^1H NMR (CDCl₃) δ : 2.48 (1H, dd, J=10.5, 14.5 Hz), 3.04 (1H, dd, J=4.9, 14.5 Hz), 4.86 (1H, dd, J=4.9, 10.5 Hz), 5.31 (1H, brs), 6.86 (1H, d, J=8.3 Hz), 7.04 (1H, dd, J=2.1, 8.3 Hz), 7.28 (1H, d, J=2.1 Hz), 7.31–7.36 (1H, m), 7.41–7.42 (5H, m), 7.57–7.60 (2H, m), 7.84–7.89 (1H, m)

FAB-MS (m/e) : 498 [M+H]⁺

10

実施例1217 ($R^1 : H ; R^2 : H ; R^3 : 1-naphthylmethy$
 $l ; R^4 : H ; Z : Ph ; R : Ph$)

^1H NMR (CDCl₃) δ : 2.54 (1H, dd, J=9.8, 14.5 Hz), 3.02 (1H, dd, J=5.2, 14.5 Hz), 4.84 (1H, dd, J=5.2, 9.8 Hz), 5.61 (1H, brs), 7.32–7.34 (1H, m), 7.33–7.36 (4H, m), 7.39–7.43 (3H, m), 7.57–7.61 (2H, m), 7.87–7.89 (2H, m)

FAB-MS (m/e) : 624 [M+H]⁺

20 実施例1218 ($R^1 : H ; R^2 : H ; R^3 : 4-F-PhCH_2 ; R^4 : H ; Z : Ph ; R : Ph$)

ESI-MS (m/e) : 374 [M+H]⁺

25 実施例1219 ($R^1 : H ; R^2 : H ; R^3 : 1-naphthylmethy$
 $l ; R^4 : H ; Z : Ph ; R : 4-Cl-Ph$)

ESI-MS (m/e) : 406 [M+H]⁺

実施例1220 ($R^1 : H ; R^2 : H ; R^3 : 4-F-PhCH_2 ; R^4 : H ; Z : Ph ; R : 4-Cl-Ph$)

200

E S I - M S (m/e) : 408 [M+H]⁺

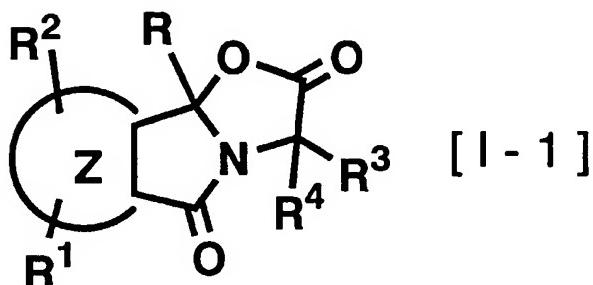
実施例 1221 (R¹: H; R²: H; R³: i-Pr; R⁴: Me; Z: Ph; R: Ph)

5 ¹HNMR (CDCl₃) δ: 0.93 (3H, d, J=6.8Hz), 0.98 (3H, d, J=6.8Hz), 1.57-1.59 (1H, m), 1.70 (3H, s), 7.31-7.56 (8H, m), 7.86-7.89 (1H, m)
FAB-MS (m/e) : 322 [M+H]⁺

10 実施例 1222 (R¹: H; R²: H; R³: Me; R⁴: Me; Z: Ph; R: Ph)

¹HNMR (CDCl₃) δ: 1.27 (3H, s), 1.87 (3H, s), 7.35-7.40 (4H, m), 7.49-7.58 (4H, m), 7.86-7.89 (1H, m)

15 FAB-MS (m/e) : 294 [M+H]⁺



実施例 1223 (R¹: H; R²: H; R³及びR⁴: =CH₂ (R³及びR⁴が一緒にになって=CH₂基を形成する); Z: Ph; R: Ph)

¹HNMR (CDCl₃) δ: 5.97 (2H, d, J=4.3Hz), 7.35-7.42 (3H, m), 7.45-7.53 (3H, m), 7.57-7.68 (2H, m), 7.94-7.98 (1H, m)

FAB-MS (m/e) : 278 [M+H]⁺

実施例 1224 ($R^1 : H$; $R^2 : H$; R^3 及び $R^4 : =CHMe$ (R^3 及び R^4 が一緒になって $=CHMe$ 基を形成する); $Z : Ph$; $R : Ph$)

1H NMR (CDCl₃) δ : 2.25 (3H, d, J=7.3Hz), 6.66 (1H, q, J=7.3Hz), 7.37-7.42 (3H, m), 7.48-5.74 (3H, m), 7.59-7.67 (2H, m), 7.91-7.93 (2H, m)
FAB-MS (m/e) : 292 [M+H]⁺

実施例 1225 ($R^1 : H$; $R^2 : H$; R^3 及び $R^4 : -(CH_2)_4-$ (R^3 及び R^4 が一緒になって $-(CH_2)_4-$ 基を形成する); $Z : Ph$; $R : Ph$)
 1H NMR (CDCl₃) δ : 1.50-2.30 (7H, m), 3.00-3.15 (1H, m), 7.30-7.42 (4H, m), 7.43-7.52 (2H, m), 7.52-7.62 (2H, m), 7.82-7.92 (1H, m)
FAB-MS (m/e) : 320 [M+H]⁺

15 実施例 1413 ($R^1 : H$; $R^2 : H$; $R^3 : i-Pr$; $R^4 : H$; $Z : 2, 3-pyrazinyl$; $R : 4-n-PrNHCOCH_2O-Ph$)
FAB-MS (m/e) : 425 [M+H]⁺

20 実施例 1427 ($R^1 : H$; $R^2 : H$; $R^3 : D-Glutamic Acid$; $R^4 : H$; $Z : Ph$; $R : 3-Me-4-n-PrNHCOCH_2O-Ph$)
 1H NMR (CDCl₃) δ : 0.92 (3H, t, J=7.4Hz), 1.54-1.61 (2H, m), 2.14-2.24 (2H, m), 2.28 (3H, s), 2.58-2.65 (2H, m), 3.34 (2H, q, J=6.6Hz), 4.25 (2H, s), 4.63 (1H, dd, J=5.2, 11.0Hz), 6.52-6.56 (1H, m), 6.78 (1H, d, J=8.2Hz), 7.27 (1H, s), 7.32 (1H, d, J=8.2Hz), 7.35-7.39 (1H, m), 7.58-7.63 (2H, m), 7.89-7.92 (1H, m)

FAB-MS (m/e) : 467 [M+H]⁺

- 実施例1428 (R¹:H; R²:H; R³:L-Glutamic Acid;
R⁴:H; Z:Ph; R:3-Me-4-n-PrNHCOCH₂O-Ph)
- 5 ¹HNMR (CDCl₃) δ: 0.92 (3H, t, J=7.4Hz), 1.54–
1.61 (2H, m), 2.14–2.24 (2H, m), 2.28 (3H, s),
2.58–2.65 (2H, m), 3.34 (2H, q, J=6.6Hz), 4.
50 (2H, s), 4.63 (1H, dd, J=5.2, 11.0Hz), 6.
52–6.56 (1H, m), 6.78 (1H, d, J=8.2Hz), 7.2
10 7 (1H, s), 7.32 (1H, d, J=8.2Hz), 7.35–7.39
(1H, m), 7.58–7.63 (2H, m), 7.89–7.92 (1H,
m)

FAB-MS (m/e) : 467 [M+H]⁺

- 15 実施例1429 (R¹:H; R²:H; R³: (3-Pyridyl)CH₂; R
4:H; Z:Ph; R:3-Me-4-n-PrNHCOCH₂O-Ph)
- 1¹HNMR (CDCl₃) δ: 0.93 (3H, t, J=7.4Hz), 1.54–
1.68 (2H, m), 2.27 (3H, s), 2.62 (1H, dd, J=1
1.0, 14.4Hz), 3.17 (1H, dd, J=4.7, 14.4Hz),
20 3.33 (2H, q, J=6.7Hz), 4.90 (1H, dd, J=4.5,
10.9Hz), 6.64–6.68 (1H, m), 6.82 (1H, d, J=
8.3Hz), 7.14 (1H, d, J=1.8Hz), 7.26–7.36 (3
H, m), 7.56–7.64 (2H, m), 7.72–7.75 (2H, m),
7.84–7.87 (1H, m)
- 25 FAB-MS (m/e) : 486 [M+H]⁺

実施例1430 (R¹:H; R²:H; R³: i-Pr; R⁴:H; Z:Ph; R:
4-n-PrNHCOCH₂O-3-CH₂=CH-Ph)

¹HNMR (CDCl₃) δ: 0.92 (3H, d, J=6.5Hz), 0.95

(3H, t, J=7. 3Hz), 1. 12 (3H, d, J=6. 5Hz), 1.
 23 - 1. 35 (1H, m), 1. 50 - 1. 67 (2H, m), 3. 33 (2
 H, q, J=6. 8Hz), 4. 21 (1H, d, J=9. 9Hz), 4. 53
 (2H, s), 5. 40 (1H, d, J=11. 2Hz), 5. 76 (1H, d,
 5 J=17. 7Hz), 6. 44 - 6. 48 (1H, m), 6. 85 (1H, d,
 J=8. 8Hz), 6. 96 (1H, dd, J=11. 2, 17. 7Hz), 7.
 27 - 7. 40 (3H, m), 7. 59 - 7. 61 (2H, m), 7. 90 - 7.
 93 (1H, m)

FAB-MS (m/e) : 449 [M+H]⁺

10

実施例1431 (R¹:H; R²:H; R³:i-Pr; R⁴:H; Z:Ph; R:
 4-n-PrNHCOCH₂O-3-(2-Pyridyl)-Ph)

¹HNMR (CDCl₃) δ: 0. 82 (3H, t, J=7. 4Hz), 0. 98
 (3H, d, J=6. 6Hz), 1. 14 (3H, d, J=6. 6Hz), 1.
 43 - 1. 55 (2H, m), 1. 65 - 1. 77 (1H, m), 3. 25 (2
 H, q, J=6. 5Hz), 4. 23 (1H, d, J=9. 9Hz), 4. 62
 (2H, d, J=14. 9Hz), 7. 05 (1H, d, J=8. 7Hz), 7.
 32 - 7. 40 (2H, m), 7. 50 - 7. 63 (5H, m), 7. 81 - 7.
 86 (1H, m), 7. 90 - 7. 92 (1H, m), 8. 195 - 8. 197
 20 (1H, m)

FAB-MS (m/e) : 500 [M+H]⁺

実施例1432 (R¹:H; R²:H; R³:i-Pr; R⁴:H; Z:Ph; R:
 4-n-PrNHCOCH₂O-3-(3-Pyridyl)-Ph)

¹HNMR (CDCl₃) δ: 0. 80 (3H, t, J=7. 4Hz), 0. 99
 (3H, d, J=6. 6Hz), 1. 15 (3H, d, J=6. 6Hz), 1.
 37 - 1. 42 (2H, m), 1. 65 - 1. 75 (1H, m), 3. 18 (2
 H, q, J=6. 7Hz), 4. 24 (1H, d, J=9. 9Hz), 4. 50
 (2H, d, J=14. 2Hz), 6. 10 - 6. 12 (1H, m), 6. 99

(1H, d, J=8. 7Hz), 7. 37-7. 42 (2H, m), 7. 44 (1H, d, J=2. 4Hz), 7. 56-7. 65 (3H, m), 7. 77 (1H, dd, J=1. 8, 7. 8Hz), 7. 91-7. 94 (1H, m), 8. 63-8. 72 (2H, m)

5 FAB-MS (m/e) : 500 [M+H]⁺

実施例1433 (R¹:H; R²:H; R³:i-Pr; R⁴:H; Z:Ph; R:4-n-PrNHCOC₂O-3-(4-Pyridyl)-Ph)

¹HNMR (CDCl₃) δ: 0. 82 (3H, t, J=7. 4Hz), 0. 98 (3H, d, J=6. 6Hz), 1. 15 (3H, d, J=6. 6Hz), 1. 38-1. 48 (2H, m), 1. 64-1. 74 (1H, m), 3. 19 (2H, q, J=6. 4Hz), 4. 24 (1H, d, J=9. 9Hz), 4. 52 (2H, d, J=14. 2Hz), 6. 14-6. 16 (1H, m), 6. 99 (1H, d, J=8. 6Hz), 7. 36-7. 44 (3H, m), 7. 47 (1H, d, J=2. 4Hz), 7. 54-7. 65 (3H, m), 7. 91-7. 94 (1H, m), 8. 69-8. 76 (2H, m)

FAB-MS (m/e) : 500 [M+H]⁺

実施例1434 (R¹:H; R²:H; R³:i-Pr; R⁴:H; Z:Ph; R:3-Ph-4-n-PrNHCOC₂O-Ph)

¹HNMR (CDCl₃) δ: 0. 79 (3H, t, J=7. 4Hz), 0. 99 (3H, d, J=6. 6Hz), 1. 15 (3H, d, J=6. 6Hz), 1. 26-1. 40 (2H, m), 1. 65-1. 76 (1H, m), 3. 14 (2H, q, J=7. 1Hz), 4. 23 (1H, d, J=9. 9Hz), 4. 48 (2H, d, J=14. 3Hz), 6. 25 (1H, s), 6. 94 (1H, d, J=8. 6Hz), 7. 37-7. 45 (7H, m), 7. 51 (1H, dd, J=2. 5, 8. 6Hz), 7. 57-7. 62 (2H, m), 7. 89-7. 92 (1H, m)

FAB-MS (m/e) : 499 [M+H]⁺

実施例 1435 (R¹:H; R²:H; R³:i-Pr; R⁴:H; Z:Ph; R:
3-Et-4-n-Pr NHCOCH₂O-Ph)

¹HNMR (CDCl₃) δ: 0. 93 (3H, t, J=7. 4Hz), 0. 94
(3H, d, J=6. 6Hz), 1. 11 (3H, d, J=6. 6Hz), 1.
5 2. 1 (3H, t, J=7. 5Hz), 1. 53-1. 68 (3H, m), 2. 6
1-2. 73 (2H, m), 3. 33 (2H, q, J=6. 6Hz), 4. 20
(1H, d, J=9. 9Hz), 4. 50 (2H, s), 6. 48-6. 49 (1
H, m), 6. 80 (1H, d, J=8. 6Hz), 7. 28 (1H, d, J=
2. 2Hz), 7. 34 (1H, dd, J=2. 2, 8. 6Hz), 7. 341-
10 7. 347 (1H, m), 7. 58-7. 62 (2H, m), 7. 90-7. 9
3 (1H, m)

FAB-MS (m/e) : 451 [M+H]⁺

実施例 1436 (R¹:H; R²:H; R³:i-Pr; R⁴:H; Z:Ph; R:
3-n-Bu-4-n-Pr NHCOCH₂O-Ph)

¹HNMR (CDCl₃) δ: 0. 92 (3H, t, J=7. 3Hz), 0. 93
(3H, t, J=7. 3Hz), 1. 11 (3H, d, J=6. 8Hz), 1.
24-1. 42 (6H, m), 1. 28 (3H, d, J=6. 8Hz), 1. 5
3-1. 64 (1H, m), 2. 51-2. 71 (2H, m), 3. 33 (2H,
20 q, J=6. 6Hz), 4. 20 (1H, d, J=9. 9Hz), 4. 49 (2
H, s), 6. 47-6. 49 (1H, m), 6. 79 (1H, d, J=8. 4
Hz), 7. 25 (1H, d, J=2. 4Hz), 7. 33 (1H, dd, J=
2. 4, 8. 4Hz), 7. 33-7. 36 (1H, m), 7. 56-7. 61
(2H, m), 7. 90-7. 92 (1H, m)

25 FAB-MS (m/e) : 479 [M+H]⁺

実施例 1437 (R¹:H; R²:H; R³:i-Pr; R⁴:H; Z:Ph; R:
3-MeO-6-Me-Ph)

¹HNMR (CDCl₃) δ: 0. 84 (3H, d, J=6. 2Hz), 1. 11

(3H, d, J=6. 2Hz), 1. 61-1. 68 (1H, m), 1. 73 (3H, s), 3. 86 (3H, s), 4. 23 (1H, d, J=9. 6Hz), 6. 82 (1H, dd, J=2. 1, 8. 2Hz), 6. 99 (1H, d, J=8. 2Hz), 7. 30-7. 31 (1H, m), 7. 46 (1H, d, J=2. 1Hz), 7. 60-7. 61 (2H, m), 7. 92-7. 95 (1H, m)

5 FAB-MS (m/e) : 352 [M+H] +

実施例1438 (R¹:H; R²:H; R³:i-Pr; R⁴:H; Z:Ph; R:3-HO-6-Me-Ph)

10 ¹HNMR (CDCl₃) δ : 0. 84 (3H, d, J=6. 6Hz), 1. 10 (3H, d, J=6. 6Hz), 1. 62-1. 67 (1H, m), 1. 71 (3H, s), 4. 24 (1H, d, J=9. 5Hz), 5. 72-5. 73 (1H, m), 6. 81 (1H, dd, J=2. 3, 8. 0Hz), 6. 94 (1H, d, J=8. 0Hz), 7. 28-7. 31 (1H, m), 7. 42 (1H, d, J=2. 3Hz), 7. 59-7. 64 (2H, m), 7. 93-7. 96 (1H, m)

15 FAB-MS (m/e) : 338 [M+H] +

実施例1439 (R¹:H; R²:H; R³:i-Pr; R⁴:H; Z:Ph; R:6-Me-3-n-PrNHCOC₂O-Ph)

20 ¹HNMR (CDCl₃) δ : 0. 82 (3H, d, J=6. 7Hz), 0. 98 (3H, t, J=7. 4Hz), 1. 12 (3H, d, J=6. 7Hz), 1. 58-1. 72 (3H, m), 1. 75 (3H, s), 3. 37 (2H, q, J=6. 7Hz), 4. 26 (1H, d, J=9. 4Hz), 4. 51-4. 52 (2H, m), 6. 70-6. 71 (1H, m), 6. 81 (1H, dd, J=2. 7, 8. 3Hz), 7. 04 (1H, d, J=8. 3Hz), 7. 27-7. 28 (1H, m), 7. 30 (1H, d, J=2. 7Hz), 7. 54-7. 65 (2H, m), 7. 94-7. 96 (1H, m)

25 FAB-MS (m/e) : 437 [M+H] +

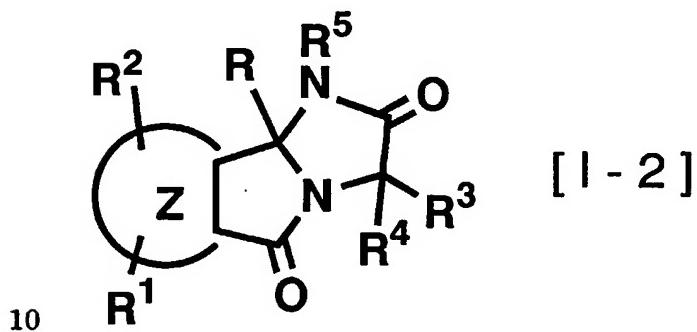
実施例 2002

- 3-(1-メチルエチル)-9b-フェニル-1H-イミダゾ[2,1-a]イソインドール-2,5(3H,9bH)-ジオン (一般式 [I-2]において、
 $R^1 : H ; R^2 : H ; R^3 : i-Pr ; R^4 : H ; R^5 : H ; Z : Ph ; R : Ph$ の
5 化合物)
- N-t-ブトキシカルボニル-D-バリン 106 mg (0.49 mmol) の
N, N-ジメチルホルムアミド溶液 (1 ml) に、室温で、1-ヒドロキシベン
ゾトリアゾール水和物 100 mg (0.73 mmol)、1-(3-ジメチルア
ミノプロピル)-3-エチルカルボジイミド塩酸塩 113 mg (0.58 mmol)
10 及び 28% アンモニア水溶液 (3 ml) を加え、反応溶液を室温で 12 時間
攪拌した。反応溶液に水及び酢酸エチルエステルを加え、有機層を乾燥し、減圧
下に濃縮した。得られた残渣をフラッシュシリカゲルカラムクロマトグラフィー
により精製し、アミド 80 mg (収率: 76%)を得た。得られたアミド 80 m
g (0.37 mmol) を室温で 4N 塩酸の 1,4-ジオキサン溶液 (2 ml)
15 に溶解し、室温で、反応溶液を 1 時間攪拌後、減圧下に濃縮した。得られた残渣
と 2-ベンゾイル安息香酸 83 mg (0.37 mmol) のジメチルホルムアミ
ド溶液 (2 ml) に、室温で、1-ヒドロキシベンゾトリアゾール水和物 60 m
g (0.63 mmol)、1-(3-ジメチルアミノプロピル)-3-エチルカ
ルボジイミド塩酸塩 85 mg (0.44 mmol) 及びトリエチルアミン 0.1
20 2 ml (0.85 mmol) を順次加え、反応溶液を室温で 12 時間攪拌した。
反応溶液に室温で水及び酢酸エチルエステルを加え、有機層を乾燥し、減圧下に
濃縮した。得られた残渣をフラッシュシリカゲルカラムクロマトグラフィーによ
り精製し、縮合化合物 130 mg (収率: 99%)を得た。得られた縮合化合物
13 mg (0.040 mmol) のトルエン溶液 (2 ml) に、p-トルエンス
25 ルホン酸 (10 mg) を室温で加え、反応溶液を加熱還流下 4 時間攪拌した。反
応溶液を減圧下に濃縮し、得られた残渣をトルエンで共沸を 3 回繰り返し、減圧
下に濃縮した。得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(ヘキサン:
酢酸エチルエステル = 2:1) により精製し、表題化合物 2.0 mg (収率: 1
6%) を無色油状物として得た。

¹H NMR (CDCl₃) δ : 0.81 (3H, d, J=6.6 Hz), 1.14 (3H, d, J=6.6 Hz), 1.70–1.83 (1H, m), 4.15 (1H, d, J=8.6 Hz), 7.30–7.35 (5H, m), 7.50–7.54 (2H, m), 7.89–7.93 (1H, m), 8.09 (1H, br s)

5 FAB-MS (m/e) : 307 [M+H]⁺

実施例 2002 と同様にして、前記の化合物リストの一般式 [I-2] の化合物の化合物番号に対応する実施例 2011、2050、2074、2467、2471、2472 及び 2474 の化合物を得た。以下にこれらの物理定数を示す。



実施例 2011 (R¹: H; R²: H; R³: i-Pr; R⁴: H; R⁵: H; Z: Ph; R: 4-MeO-Ph)

¹H NMR (CDCl₃) δ : 0.86 (3H, d, J=6.8 Hz), 1.19 (3H, d, J=6.8 Hz), 1.77–1.85 (1H, m), 3.79 (3H, s), 4.16 (1H, d, J=8.6 Hz), 6.84 (2H, d, J=8.9 Hz), 7.22–7.88 (6H, m), 9.55 (1H, br s)

15 ESI-MS (m/e) : 337 [M+H]⁺

20 実施例 2050 (R¹: H; R²: H; R³: i-Pr; R⁴: H; R⁵: H; Z: Ph; R: 3-NH₂-4-C1-Ph)

¹H NMR (CDCl₃) δ : 0.89 (3H, d, J=6.7 Hz), 1.17 (3H, d, J=6.7 Hz), 1.77–1.88 (1H, m), 4.13 (1

H, d, J=8. 7 Hz), 6. 67 (1H, dd, J=2. 2, 8. 3 Hz),
6. 77 (1H, d, J=2. 2 Hz), 7. 19 (1H, d, J=8. 3 Hz),
7. 21-7. 88 (4H, m), 9. 02 (1H, s)

ESI-MS (m/e) : 356 [M+H]⁺

5

実施例2074 (R¹:H; R²:H; R³:i-Pr; R⁴:H; R⁵:H; Z:
Ph; R:3-I-4-n-PrNHCOCH₂O-Ph)

¹HNMR (CDCl₃) δ: 0. 86 (3H, d, J=6. 7 Hz), 0. 98
(3H, t, J=7. 4 Hz), 1. 17 (3H, d, J=6. 7 Hz), 1.
10 5. 5-1. 78 (3H, m), 3. 35 (2H, q, J=7. 0 Hz), 4. 1
6 (1H, d, J=8. 8 Hz), 4. 50 (2H, s), 6. 73 (1H, d,
J=8. 6 Hz), 6. 92 (1H, brs), 7. 16-7. 93 (6H, m),
8. 98 (1H, brs)

FAB-MS (m/e) : 548 [M+H]⁺

15

実施例2467 (R¹:H; R²:H; R³:i-Pr; R⁴:H; R⁵:H; Z:
Ph; R:4-n-PrNHCOCH₂O-pyrimidin-5-yl)

FAB-MS (m/e) : 424 [M+H]⁺

20 実施例2471 (R¹:H; R²:H; R³:i-Pr; R⁴:H; R⁵:Me;
Z:Ph; R:4-n-PrNHCOCH₂O-Ph)

¹HNMR (CDCl₃) δ: 0. 76 (3H, d, J=6. 6 Hz), 0. 91
(3H, d, J=7. 4 Hz), 1. 17 (3H, d, J=6. 6 Hz), 1.
52-1. 68 (3H, m), 3. 13 (3H, s), 3. 31 (2H, dt,

25 J=6. 6, 7. 3 Hz), 4. 03 (1H, d, J=10. 0 Hz), 4. 4
8 (2H, s), 6. 53 (1H, brs), 6. 85-8. 00 (8H, m)

FAB-MS (m/e) : 436 [M+H]⁺

実施例2472 (R¹:H; R²:H; R³:i-Pr; R⁴:H; R⁵:n-P

r NHCOCH₂; Z: Ph; R: 4-n-PrNHCOCH₂O-Ph)

¹H NMR (CDCl₃) δ: 0.61 (3H, t, J=7.4 Hz), 0.81 (3H, d, J=6.5 Hz), 0.93 (3H, t, J=7.4 Hz), 1.01-1.11 (2H, m), 1.20 (3H, d, J=6.5 Hz), 1.55 1-1.68 (3H, m), 2.83-2.97 (2H, m), 3.32 (2H, t, J=7.3 Hz), 4.17 (1H, d, J=10.5 Hz), 4.33 (2H, d, J=16.2 Hz), 4.50 (2H, s), 5.69 (1H, br s), 6.52 (1H, br s), 6.87-8.00 (8H, m)
FAB-MS (m/e) : 521 [M+H]⁺

10

実施例2474 (R¹: H; R²: H; R³: i-Pr; R⁴: H; R⁵: MeS
O₂NHCOCH₂; Z: Ph; R: 4-n-PrNHCOCH₂O-Ph)
FAB-MS (m/e) : 557 [M+H]⁺

15 実施例3011

9b-(4-メトキシフェニル)-3-(1-メチルエチル)-1H-ピロロ[2,1-a]イソインドール-2,5(3H, 9bH)-ジオン (一般式[I-3]において、R¹: H; R²: H; R³: i-Pr; R⁴: H; R⁶: H; Z: Ph; R: 4-MeO-Phの化合物)

20 N-t-ブトキシカルボニル-D-バリン2.5g (12.0mmol) のテトラヒドロフラン溶液 (500ml) にトリエチルアミン5.5ml (39.0mmol)、クロルギ酸エチルエステル1.3ml (14.0mmol) を-40℃で加え、反応溶液を-40℃で2時間攪拌後、-40℃において、N, O-ジメチルヒドロキシリルアミン塩酸塩2.3g (23.0mmol) を加え、0℃において1時間攪拌後25 塩化アンムニウム水を添加した。酢酸エチルエステルで抽出し、有機層を飽和食塩水溶液で洗浄後、乾燥し、減圧下に濃縮した。得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー (ヘキサン: 酢酸エチルエステル=7:3) により精製し、アミド1.8g (収率: 61%)を得た。得られたアミド4.9g (18.9mmol) のテトラヒドロフラン溶液 (100ml) に-70℃にて、メチルマグネ

シウムプロミド（3. 0 M）－ジエチルエーテル溶液 19. 0 ml (56. 6 mmol) を滴下し、室温にて反応溶液を 2 時間攪拌後、反応溶液に塩化アンモニウム水を添加した。酢酸エチルエステルで抽出し、有機層を飽和食塩水溶液で洗浄し、乾燥し、減圧下濃縮した。得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラ

5 フィー（ヘキサン：酢酸エチルエステル = 8 : 1）により精製し、ケトン 2. 0 g (収率: 50%)を得た。

得られたケトン 2. 0 g (0. 22 mmol) を室温で 4 N 塩酸の 1, 4-ジオキサン溶液 (20 ml) に溶解し、反応溶液を室温で 1 時間攪拌後減圧下に濃縮し、アミン塩酸塩 1. 4 g (収率: 99%)を得た。アミン塩酸塩 510 mg
10 (3. 4 mmol) を塩化メチレン (32 ml) に溶解し、反応溶液に室温で 1-ヒドロキシベンゾトリアゾール水和物 590 mg (4. 4 mmol)、2-(4-メトキシベンゾイル) 安息香酸 860 mg (3. 4 mmol)、1-(3-ジメチルアミノプロピル)-3-エチルカルボジイミド塩酸塩 840 mg (4. 4 mmol) 及びトリエチルアミン 1. 8 ml (13. 5 mmol) を順次加え、室
15 温にて反応溶液を 12 時間攪拌後、反応溶液に水を添加した。酢酸エチルエステルで抽出し、有機層を飽和炭酸水素ナトリウム水溶液及び飽和食塩水溶液で洗浄後、乾燥し、減圧下に濃縮した。得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラ
フィー（ヘキサン：酢酸エチルエステル = 3 : 2）により精製し、縮合生成物 990 mg (収率: 83%)を得た。得られた縮合化合物 890 mg (2. 5 mm
20 ol) の塩化メチレン (50 ml) 溶液にトリエチルアミン 2. 1 ml (15 mmol)、トリフルオロメタンスルホン酸トリメチルシリルエ斯特尔 2. 7 ml (15 mmol) を順次加え、室温にて反応溶液を 2 時間攪拌後、-70 °C にて
三フッ化ホウ素ジエチルエーテル錯体 6. 4 ml (50 mmol) を加え、反応溶液を室温で 12 時間攪拌した。反応溶液に水を添加した。クロロホルムで抽出
25 し、有機層を飽和塩化アンモニウム水溶液及び飽和食塩水溶液で洗浄後、乾燥し、減圧下に濃縮した。得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー（ヘキサン：酢酸エチルエステル = 4 : 1）により精製し表題化合物のジアステレオマー A 94 mg (収率: 11%) を無色油状物として、ジアステレオマー B 306 mg (収率: 36%) を無色油状物として得た。

ジアステレオマーA

¹HNMR (CDCl₃) δ : 0. 86 (3H, d, J=7. 0Hz), 1. 19
 (3H, d, J=7. 0Hz), 2. 59 (1H, d, J=15. 9Hz), 3.
 44 (1H, d, J=15. 9Hz), 3. 63-3. 71 (1H, m), 3.
 5 7. 6 (3H, s), 3. 78 (1H, d, J=3. 2Hz), 6. 83 (2H,
 d, J=8. 9Hz), 7. 23-7. 28 (1H, m), 7. 35-7. 37
 (1H, m), 7. 43-7. 54 (2H, m), 7. 87-7. 90 (1H,
 m)

ESI-MS (m/e) : 336 [M+H]⁺

10 ジアステレオマーB

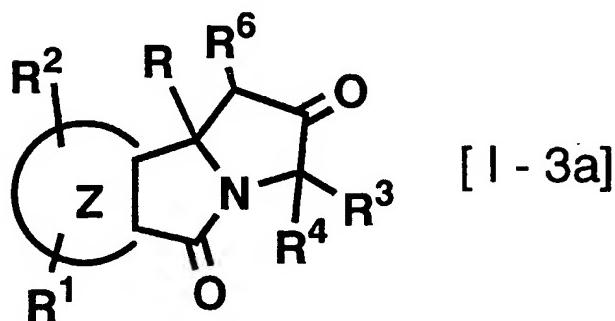
¹HNMR (CDCl₃) δ : 0. 85 (3H, d, J=6. 7Hz), 1. 09
 (3H, d, J=6. 7Hz), 1. 50-1. 70 (1H, m), 2. 53 (1
 H, d, J=17. 4Hz), 3. 60 (1H, d, J=17. 4Hz), 3.
 79 (3H, s), 4. 01 (1H, d, J=9. 6Hz), 6. 84 (2H,
 d, J=9. 0Hz), 7. 14-7. 24 (1H, m), 7. 21 (2H, d,
 J=9. 0Hz), 7. 45-7. 54 (2H, m), 7. 90-7. 93 (1
 H, m)

ESI-MS (m/e) : 336 [M+H]⁺

20 実施例3011と同様にして、前記の化合物リストの一般式[I-3a]の化
 合物、一般式[I-3b]の化合物、一般式[I-3c]の化合物又は一般式[I-
 3d]の化合物の化合物番号に対応する実施例3001、3002、3007、
 3014、3015、3020、3023、3024、3033、3039、3
 047、3050、3051、3056、3057、3058、3061、30
 25 63、3065、3072、3073、3074、3082、3092、309
 3、3094、3095、3096、3103、3104、3107、3112、
 3115、3117、3126、3129、3134、3226、3241、3
 246、3258、3266、3296、3307、3319、3412、34
 18、3464、3472、3473、3474、3475、3476、347

7、3478、3479、3480、3481、3482、3485、3486、
 3487、3488、3489、3492、3499、3500、3501、3
 509、3510、3511、3515及び3516の化合物を得た。以下にこ
 れらの物理定数を示す。

5



実施例 3001 ($R^1 : H$; $R^2 : H$; $R^3 : i-Pr$; $R^4 : H$; $R^6 : H$;
 $Z : Ph$; $R : 2-MeO-Ph$)

10 ジアステレオマーA

1H NMR ($CDCl_3$) δ : 0.85 (3H, d, $J = 7.0\text{ Hz}$), 1.21
 (3H, d, $J = 7.0\text{ Hz}$), 2.61 (1H, d, $J = 16.7\text{ Hz}$), 3.
 67–3.78 (1H, m), 3.86 (1H, d, $J = 16.7\text{ Hz}$), 3.
 87 (1H, d, $J = 3.2\text{ Hz}$), 4.01 (3H, s), 6.87 (1H,
 15 t, $J = 7.4\text{ Hz}$), 6.94 (1H, d, $J = 8.0\text{ Hz}$), 7.22–7.
 28 (2H, m), 7.41–7.50 (2H, m), 7.83 (1H, dd,
 $J = 1.6, 7.4\text{ Hz}$), 7.90 (1H, d, $J = 6.3\text{ Hz}$)
 ESI-MS (m/e) : 336 [$M+H$] $^+$

ジアステレオマーB

20 1H NMR ($CDCl_3$) δ : 1.13 (6H, d, $J = 6.6\text{ Hz}$), 1.69–
 1.74 (1H, m), 2.64 (1H, d, $J = 18.1\text{ Hz}$), 3.89 (3
 H, brs), 3.97 (1H, d, $J = 18.1\text{ Hz}$), 4.00 (1H, d,
 $J = 10.3\text{ Hz}$), 6.88 (1H, t, $J = 7.6\text{ Hz}$), 6.94 (1H,

d, J=8. 2 Hz), 7. 30 (1H, t, J=8. 2 Hz), 7. 41-7. 50 (3H, m), 7. 61 (1H, br s), 7. 86 (1H, d, J=6. 5 Hz)

E S I - M S (m/e) : 336 [M+H]⁺

5

実施例3002 (R¹:H; R²:H; R³:i-Pr; R⁴:H; R⁶:H; Z:Ph; R:Ph)

¹HNMR (CDCl₃) δ: 0. 87 (3H, d, J=6. 7 Hz), 1. 09 (3H, d, J=6. 6 Hz), 1. 49-1. 70 (1H, m), 2. 58 (1H, d, J=17. 6 Hz), 3. 66 (1H, d, J=17. 6 Hz), 4. 03 (1H, d, J=9. 6 Hz), 7. 12-7. 21 (1H, m), 7. 25-7. 39 (5H, m), 7. 42-7. 56 (2H, m), 7. 89-7. 97 (1H, m)

FAB-MS (m/e) : 306 [M+H]⁺

15

実施例3007 (R¹:H; R²:H; R³:i-Pr; R⁴:H; R⁶:H; Z:Ph; R:4-HO-Ph)

¹HNMR (CDCl₃) δ: 0. 84 (3H, d, J=6. 7 Hz), 1. 09 (3H, d, J=6. 7 Hz), 1. 51-1. 64 (1H, m), 2. 52 (1H, d, J=17. 3 Hz), 3. 59 (1H, d, J=17. 3 Hz), 4. 01 (1H, d, J=9. 5 Hz), 5. 17 (1H, br s), 6. 79 (2H, d, J=8. 8 Hz), 7. 15-7. 19 (1H, m), 7. 16 (2H, d, J=8. 8 Hz), 7. 46-7. 54 (2H, m), 7. 90-7. 93 (1H, m)

25 E S I - M S (m/e) : 322 [M+H]⁺

実施例3014 (R¹:H; R²:H; R³:i-Pr; R⁴:H; R⁶:H; Z:Ph; R:4-t-BuO₂CCH₂O-Ph)

¹HNMR (CDCl₃) δ: 0. 83 (3H, d, J=6. 6 Hz), 1. 08

(3H, d, J=6. 6Hz), 1. 45-1. 46 (9H, m), 1. 49-
 1. 67 (1H, m), 2. 53 (1H, d, J=17. 3Hz), 3. 59 (1
 H, d, J=17. 3Hz), 4. 01 (1H, d, J=9. 6Hz), 4. 4
 8-4. 49 (2H, m), 6. 83 (2H, d, J=8. 9Hz), 7. 15-
 5 7. 24 (1H, m), 7. 20 (2H, d, J=8. 9Hz), 7. 45-7.
 55 (2H, m), 7. 90-7. 93 (1H, m)
 FAB-MS (m/e) : 436 [M+H]⁺

実施例3015 (R¹:H; R²:H; R³:i-Pr; R⁴:H; R⁶:H; Z:
 10 Ph; R:4-HO₂CCH₂O-Ph)
¹HNMR (CDCl₃) δ: 0. 83 (3H, d, J=6. 6Hz), 1. 08
 (3H, d, J=6. 6Hz), 1. 47-1. 59 (1H, m), 2. 56 (1
 H, d, J=17. 2Hz), 3. 61 (1H, d, J=17. 2Hz), 4.
 02 (1H, d, J=9. 6Hz), 4. 67 (2H, s), 6. 87 (2H,
 15 d, J=8. 9Hz), 7. 17 (1H, dd, J=1. 4, 6. 2Hz), 7.
 22 (2H, d, J=8. 9Hz), 7. 46-7. 56 (2H, m), 7. 9
 3 (1H, dd, J=1. 8, 6. 2Hz), 8. 65 (1H, brs)
 FAB-MS (m/e) : 380 [M+H]⁺

20 実施例3020 (R¹:H; R²:H; R³:i-Pr; R⁴:H; R⁶:H; Z:
 Ph; R:4-HOC(Me)₂(CH₂)₂O-Ph)
¹HNMR (CDCl₃) δ: 0. 87 (3H, d, J=6. 6Hz), 1. 12
 (3H, d, J=6. 6Hz), 1. 32 (6H, s), 1. 50-1. 62 (1
 H, m), 1. 99 (2H, t, J=6. 3Hz), 2. 55 (1H, d, J=
 25 16. 0Hz), 3. 62 (1H, d, J=16. 0Hz), 4. 02 (1H,
 d, J=9. 5Hz), 4. 17 (2H, t, J=6. 3Hz), 6. 86 (1
 H, d, J=8. 8Hz), 7. 18-7. 92 (6H, m)
 FAB-MS (m/e) : 408 [M+H]⁺

実施例 3023 (R¹:H; R²:H; R³:i-Pr; R⁴:H; R⁶:H; Z:Ph; R:4-EtNHCOCH₂O-Ph)

FAB-MS (m/e) : 407 [M+H]⁺

実施例 3024 (R¹:H; R²:H; R³:i-Pr; R⁴:H; R⁶:H; Z:Ph; R:4-n-PrNHCOCH₂O-Ph)

¹HNMR (CDCl₃) δ: 0.84 (3H, d, J=6.6Hz), 0.90 (3H, t, J=7.4Hz), 1.09 (3H, d, J=6.6Hz), 1.49-1.61 (3H, m), 2.55 (1H, d, J=17.4Hz), 3.30 (2H, q, J=6.8Hz), 3.60 (1H, d, J=17.4Hz), 4.02 (1H, d, J=9.5Hz), 4.47 (2H, s), 6.53 (1H, brs), 6.88 (2H, d, J=9.0Hz), 7.16 (1H, dd, J=2.2, 5.7Hz), 7.27 (2H, d, J=9.0Hz), 7.46-7.55 (2H, m), 7.92 (1H, dd, J=2.0, 5.1Hz)

FAB-MS (m/e) : 421 [M+H]⁺

15

実施例 3033 (R¹:H; R²:H; R³:i-Pr; R⁴:H; R⁶:H; Z:Ph; R:4-n-PrNHCOCH=CH-Ph)

FAB-MS (m/e) : 417 [M+H]⁺

20

実施例 3039 (R¹:H; R²:H; R³:i-Pr; R⁴:H; R⁶:H; Z:Ph; R:3-HO₂COCH₂O-Ph)

FAB-MS (m/e) : 380 [M+H]⁺

25

実施例 3047 (R¹:H; R²:H; R³:i-Pr; R⁴:H; R⁶:H; Z:Ph; R:4-C1-3-NO₂-Ph)

FAB-MS (m/e) : 385 [M+H]⁺

実施例 3050 (R¹:H; R²:H; R³:i-Pr; R⁴:H; R⁶:H; Z:Ph; R:3-NH₂-4-C1-Ph)

FAB-MS (m/e) : 355 [M+H]⁺

実施例3051 (R¹:H; R²:H; R³:i-Pr; R⁴:H; R⁶:H; Z:Ph; R:3-Cl-4-MeO-Ph)

5 FAB-MS (m/e) : 370 [M+H]⁺

実施例3056 (R¹:H; R²:H; R³:i-Pr; R⁴:H; R⁶:H; Z:Ph; R:3-F-4-Me-Ph)

10 ¹HNMR (CDCl₃) δ: 0.90 (3H, d, J=6.7Hz), 1.10
 (3H, d, J=6.7Hz), 1.53-1.65 (1H, m), 2.24 (3H, s), 2.57 (1H, d, J=17.5Hz), 3.56 (1H, d, J=17.5Hz), 4.02 (1H, d, J=9.7Hz), 6.95 (1H, dd, J=1.9, 10.7Hz), 7.02 (1H, dd, J=1.9, 7.9Hz), 7.14 (1H, d, J=7.9Hz), 7.17-7.20 (1H, m), 7.47-7.55 (2H, m), 7.90-7.93 (1H, m)

15 ESI-MS (m/e) : 338 [M+H]⁺

実施例3057 (R¹:H; R²:H; R³:i-Pr; R⁴:H; R⁶:H; Z:Ph; R:3-Br-4-HO-Ph)

20 ¹HNMR (CDCl₃) δ: 0.88 (3H, d, J=6.6Hz), 1.11
 (3H, d, J=6.6Hz), 1.53-1.70 (1H, m), 2.55 (1H, d, J=17.4Hz), 3.55 (1H, d, J=17.4Hz), 4.02 (1H, d, J=9.6Hz), 5.81 (1H, brs), 6.98 (1H, d, J=8.5Hz), 7.15-7.20 (2H, m), 7.42 (1H, d, J=2.3Hz), 7.48-7.57 (2H, m), 7.91-7.94 (1H, m)

FAB-MS (m/e) : 400/402 [M+H]⁺

実施例3058 (R¹:H; R²:H; R³:i-Pr; R⁴:H; R⁶:H; Z:

P h ; R : 3 - B r - 4 - M e O - P h)

¹H NMR (CDCl₃) δ : 0. 89 (3H, d, J = 6. 6 Hz), 1. 11 (3H, d, J = 6. 6 Hz), 1. 51 – 1. 65 (1H, m), 2. 55 (1H, d, J = 17. 4 Hz), 3. 56 (1H, d, J = 17. 4 Hz), 3. 58 (3H, s), 4. 02 (1H, d, J = 9. 6 Hz), 6. 84 (1H, d, J = 8. 6 Hz), 7. 17 – 7. 25 (2H, m), 7. 47 – 7. 56 (3H, m), 7. 91 – 7. 94 (1H, m)

FAB-MS (m/e) : 414/416 [M+H]⁺

10 実施例 3061 (R¹: H; R²: H; R³: i-Pr; R⁴: H; R⁶: H; Z: Ph; R: 4-HO-3-I-Ph)
FAB-MS (m/e) : 448 [M+H]⁺

実施例 3063 (R¹: H; R²: H; R³: i-Pr; R⁴: H; R⁶: H; Z: Ph; R: 3-I-4-MeO-Ph)
¹H NMR (CDCl₃) δ : 1. 11 (3H, d, J = 6. 6 Hz), 1. 27 (3H, d, J = 6. 6 Hz), 1. 53 – 1. 60 (1H, m), 2. 55 (1H, d, J = 16. 7 Hz), 3. 56 (1H, d, J = 16. 7 Hz), 3. 86 (3H, s), 4. 02 (1H, d, J = 9. 7 Hz), 6. 75 (1H, d, J = 8. 6 Hz), 7. 17 – 7. 94 (6H, m)
FAB-MS (m/e) : 462 [M+H]⁺

実施例 3065 (R¹: H; R²: H; R³: i-Pr; R⁴: H; R⁶: H; Z: Ph; R: 4-MeO-3-Me-Ph)
25 ¹H NMR (CDCl₃) δ : 0. 88 (3H, d, J = 6. 7 Hz), 1. 09 (3H, d, J = 6. 7 Hz), 1. 39 – 1. 62 (1H, m), 2. 15 (3H, s), 2. 51 (1H, d, J = 17. 3 Hz), 3. 60 (1H, d, J = 17. 3 Hz), 3. 80 (3H, s), 4. 00 (1H, d, J = 9. 7 Hz), 6. 74 (1H, d, J = 8. 6 Hz), 7. 01 (1H, d, J = 2.

6 Hz), 7.10-7.21 (2H, m), 7.44-7.53 (2H, m),
 7.90-7.93 (1H, m)
 FAB-MS (m/e) : 350 [M+H]⁺

5 実施例3072 (R¹:H; R²:H; R³:i-Pr; R⁴:H; R⁶:H; Z:
 Ph; R: 3-I-4-MeNHCOCH₂O-Ph)
 FAB-MS (m/e) : 519 [M+H]⁺

10 実施例3073 (R¹:H; R²:H; R³:i-Pr; R⁴:H; R⁶:H; Z:
 Ph; R: 4-EtNHCOCH₂O-3-I-Ph)
 FAB-MS (m/e) : 533 [M+H]⁺

15 実施例3074 (R¹:H; R²:H; R³:i-Pr; R⁴:H; R⁶:H; Z:
 Ph; R: 3-I-4-n-PrNHCOCH₂O-Ph)
¹HNMR (CDCl₃) δ: 0.90 (3H, d, J=6.6Hz), 0.96
 (3H, t, J=7.4Hz), 1.11 (3H, d, J=6.6Hz), 1.
 53-1.67 (3H, m), 2.57 (1H, d, J=16.7Hz), 3.
 35 (2H, q, J=6.6Hz), 3.55 (1H, d, J=16.7Hz),
 4.03 (1H, d, J=9.5Hz), 4.49 (2H, s), 6.73 (1
 20 H, d, J=8.6Hz), 6.88-6.93 (1H, m), 7.16-7.
 19 (1H, m), 7.33 (1H, dd, J=2.3, 8.6Hz), 7.4
 8-7.57 (2H, m), 7.73 (1H, d, J=2.3Hz), 7.92-
 7.95 (1H, m)
 FAB-MS (m/e) : 547 [M+H]⁺

25

実施例3082 (R¹:H; R²:H; R³:i-Pr; R⁴:H; R⁶:H; Z:
 Ph; R: 4-cycloPrNHCOCH₂O-3-I-Ph)
 FAB-MS (m/e) : 545 [M+H]⁺

実施例3092 (R¹:H; R²:H; R³:i-Pr; R⁴:H; R⁶:H; Z:Ph; R:3-C1-4-n-PrNHCOC₂O-Ph)

¹HNMR (CDCl₃) δ: 0.88 (3H, d, J=6.6Hz), 0.94 (3H, t, J=7.4Hz), 1.11 (3H, d, J=6.6Hz), 1.52-1.93 (3H, m), 2.58 (1H, d, J=16.0Hz), 3.32 (2H, q, J=6.7Hz), 3.56 (1H, d, J=16.0Hz), 4.03 (1H, d, J=9.6Hz), 4.51 (2H, s), 6.74-6.79 (1H, m), 6.87 (1H, d, J=8.6Hz), 7.16-7.19 (1H, m), 7.24 (1H, dd, J=2.4, 8.6Hz), 7.36 (1H, d, J=2.4Hz), 7.48-7.57 (2H, m), 7.92-7.96 (1H, m)

FAB-MS (m/e) : 455/457 [M+H]⁺

実施例3093 (R¹:H; R²:H; R³:i-Pr; R⁴:H; R⁶:H; Z:Ph; R:3-Br-4-n-PrNHCOC₂O-Ph)

¹HNMR (CDCl₃) δ: 0.89 (3H, d, J=6.6Hz), 0.95 (3H, t, J=7.4Hz), 1.11 (3H, d, J=6.6Hz), 1.52-1.65 (3H, m), 2.58 (1H, d, J=17.0Hz), 3.33 (2H, q, J=6.6Hz), 3.56 (1H, d, J=17.0Hz), 4.03 (1H, d, J=9.6Hz), 4.50 (2H, s), 6.82-6.85 (1H, m), 6.83 (1H, d, J=8.6Hz), 7.16-7.19 (1H, m), 7.29-7.31 (1H, m), 7.48-7.57 (3H, m), 7.88-7.94 (1H, m)

FAB-MS (m/e) : 499/501 [M+H]⁺

25

実施例3094 (R¹:H; R²:H; R³:i-Pr; R⁴:H; R⁶:H; Z:Ph; R:3-F-4-n-PrNHCOC₂O-Ph)

¹HNMR (CDCl₃) δ: 0.88 (3H, d, J=6.6Hz), 0.92 (3H, t, J=7.4Hz), 1.11 (3H, d, J=6.6Hz), 1.

5.1-1.64 (3H, m), 2.58 (1H, d, J=17.5Hz), 3.
 3.0 (2H, q, J=6.8Hz), 3.55 (1H, d, J=17.5Hz),
 4.03 (1H, d, J=9.5Hz), 4.51 (2H, s), 6.61-6.
 6.4 (1H, m), 6.92 (1H, t, J=8.5Hz), 7.04 (1H,
 5d, J=11.9Hz), 7.07-7.18 (2H, m), 7.48-7.5
 7 (2H, m), 7.91-7.98 (1H, m)
 FAB-MS (m/e) : 439 [M+H]⁺

実施例3095 (R¹:H; R²:H; R³:i-Pr; R⁴:H; R⁶:H; Z:
 10 Ph; R: 3-Me-4-n-Pr NHCOCH₂O-Ph)
¹HNMR (CDCl₃) δ: 0.87 (3H, d, J=6.7Hz), 0.92
 (3H, t, J=7.4Hz), 1.09 (3H, d, J=6.7Hz), 1.
 49-1.59 (3H, m), 2.23 (3H, s), 2.54 (1H, d, J
 =17.3Hz), 3.21 (2H, q, J=6.7Hz), 3.58 (1H,
 15 d, J=17.3Hz), 4.01 (1H, d, J=9.6Hz), 4.47 (2
 H, s), 6.49-6.51 (1H, m), 6.73 (1H, d, J=8.6
 Hz), 7.08 (1H, d, J=2.0Hz), 7.14-7.18 (2H,
 m), 7.46-7.54 (2H, m), 7.90-7.93 (1H, m)
 FAB-MS (m/e) : 435 [M+H]⁺

20

実施例3096 (R¹:H; R²:H; R³:i-Pr; R⁴:H; R⁶:H; Z:
 Ph; R: 4-Et NHCOCH₂O-3-F-Ph)
 FAB-MS (m/e) : 425 [M+H]⁺

25 実施例3103 (R¹:H; R²:H; R³:i-Pr; R⁴:H; R⁶:H; Z:
 Ph; R: 3-F-4-HO-Ph)
¹HNMR (CDCl₃) δ: 0.87 (3H, d, J=6.7Hz), 1.11
 (3H, d, J=6.7Hz), 1.54-1.66 (1H, m), 2.55 (1
 H, d, J=17.3Hz), 3.54 (1H, d, J=17.3Hz), 4.

0.2 (1H, d, J=9.6 Hz), 5.38-5.41 (1H, m), 6.9
 4-7.05 (3H, m), 7.16-7.19 (1H, m), 7.47-7.
 57 (2H, m), 7.91-7.94 (1H, m)
 FAB-MS (m/e) : 340 [M+H]⁺

5

実施例3104 (R¹:H; R²:H; R³:i-Pr; R⁴:H; R⁶:H; Z:
 Ph; R:3-F-4-MeO-Ph)

ジアステレオマーA

¹HNMR (CDCl₃) δ: 0.85 (3H, d, J=6.9 Hz), 1.19
 10 (3H, d, J=6.9 Hz), 2.60 (1H, d, J=16.0 Hz), 3.
 40 (1H, d, J=16.0 Hz), 3.63-3.69 (1H, m), 3.
 78 (1H, d, J=3.2 Hz), 3.84 (3H, s), 6.89 (1H,
 dd, J=7.3, 8.5 Hz), 7.02 (1H, d, J=2.3 Hz), 7.
 09 (1H, dd, J=2.3, 7.3 Hz), 7.36 (1H, dd, J=1.
 15 1, 6.2 Hz), 7.37-7.56 (2H, m), 7.89 (1H, dd,
 J=1.9, 6.9 Hz)

FAB-MS (m/e) : 354 [M+H]⁺

ジアステレオマーB

¹HNMR (CDCl₃) δ: 0.87 (3H, d, J=6.6 Hz), 1.11
 20 (3H, d, J=6.6 Hz), 1.55-1.63 (1H, m), 2.55 (1
 H, d, J=17.4 Hz), 3.55 (1H, d, J=17.4 Hz), 3.
 87 (3H, s), 4.02 (1H, d, J=9.6 Hz), 6.91 (1H,
 t, J=8.5 Hz), 6.98 (1H, dd, J=2.3, 12.2 Hz),
 7.07 (1H, ddd, J=1.1, 2.3, 8.5 Hz), 7.16-7.
 25 1.9 (1H, m), 7.48-7.56 (2H, m), 7.91-7.94 (1
 H, m)

FAB-MS (m/e) : 354 [M+H]⁺

実施例3107 (R¹:H; R²:H; R³:i-Pr; R⁴:H; R⁶:H; Z:

Ph ; R : 3, 4-Cl₂-Ph)

FAB-MS (m/e) : 375 [M+H]⁺

実施例3112 (R¹:H; R²:H; R³:i-Pr; R⁴:H; R⁶:H; Z:

Ph ; R : 3, 5-Me₂-Ph)

5 FAB-MS (m/e) : 334 [M+H]⁺

実施例3115 (R¹:H; R²:H; R³:i-Pr; R⁴:H; R⁶:H; Z:

Ph ; R : 3, 5-I₂-4-MeO-Ph).

FAB-MS (m/e) : 588 [M+H]⁺

10

実施例3117 (R¹:H; R²:H; R³:i-Pr; R⁴:H; R⁶:H; Z:

Ph ; R : 2, 4, 6-Me₃-Ph)

FAB-MS (m/e) : 348 [M+H]⁺

15

実施例3126 (R¹:6-F; R²:H; R³:i-Pr; R⁴:H; R⁶:H;

Z:Ph ; R:Ph)

FAB-MS (m/e) : 324 [M+H]⁺

20

実施例3129 (R¹:9-F; R²:H; R³:i-Pr; R⁴:H; R⁶:H;

Z:Ph ; R:Ph)

FAB-MS (m/e) : 324 [M+H]⁺

25

実施例3134 (R¹:7-NO₂; R²:H; R³:i-Pr; R⁴:H; R⁶:

H; Z:Ph ; R:Ph)

FAB-MS (m/e) : 351 [M+H]⁺

実施例3226 (R¹:H; R²:H; R³:i-Pr; R⁴:H; R⁶:H; Z:

Ph ; R : 4-n-PrNHCOCH₂CH₂O-Ph)

FAB-MS (m/e) : 435 [M+H]⁺

実施例3 2 4 6 ($R^1 : H ; R^2 : H ; R^3 : i-Pr ; R^4 : H ; R^6 : H ; Z : Ph ; R : 3-F-4-i-PrNHCOCH_2CH_2O-Ph$)
 FAB-MS (m/e) : 453 [M+H]⁺

5 実施例3 2 5 8 ($R^1 : H ; R^2 : H ; R^3 : i-Pr ; R^4 : H ; R^6 : H ; Z : Ph ; R : 3-C_1-4-EtNHCOCH_2CH_2O-Ph$)
 FAB-MS (m/e) : 455 [M+H]⁺

10 実施例3 2 6 6 ($R^1 : H ; R^2 : H ; R^3 : i-Pr ; R^4 : H ; R^6 : H ; Z : Ph ; R : 3-Me-4-n-BuNHCOCH_2CH_2O-Ph$)
 FAB-MS (m/e) : 463 [M+H]⁺

15 実施例3 2 9 6 ($R^1 : H ; R^2 : H ; R^3 : Bu ; R^4 : H ; R^6 : H ; Z : Ph ; R : 3-Me-4-MeNHCOCH_2O-Ph$)
 FAB-MS (m/e) : 421 [M+H]⁺

20 実施例3 3 0 7 ($R^1 : H ; R^2 : H ; R^3 : t-Bu ; R^4 : H ; R^6 : H ; Z : Ph ; R : 3-Me-4-n-PrNHCOCH_2O-Ph$)
 FAB-MS (m/e) : 449 [M+H]⁺

実施例3 3 1 9 ($R^1 : H ; R^2 : H ; R^3 : i-Pr ; R^4 : Me ; R^6 : H ; Z : Ph ; R : 3-C_1-4-cycloPrNHCOCH_2O-Ph$)
 FAB-MS (m/e) : 467 [M+H]⁺

25 実施例3 3 2 4 ($R^1 : H ; R^2 : H ; R^3 : i-Pr ; R^4 : H ; R^6 : H ; Z : 2,3-Pyridyl ; R : 3-Me-4-MeNHCOCH_2O-Ph$)
 FAB-MS (m/e) : 408 [M+H]⁺

実施例3 3 3 1 ($R^1 : H ; R^2 : H ; R^3 : i-Pr ; R^4 : H ; R^6 : H ; Z :$

3, 4-Pyridyl; R: 3-C1-4-EtNHCOCH₂O-Ph)
 FAB-MS (m/e) : 442 [M+H]⁺

実施例3337 (R¹:H; R²:H; R³:i-Pr; R⁴:H; R⁶:H; Z:
 5 Ph; R: 4-EtNHCOCH₂O-3-F-(2-Pyridyl))
 FAB-MS (m/e) : 446 [M+H]⁺

実施例3344 (R¹:H; R²:H; R³:i-Pr; R⁴:H; R⁶:H; Z:
 Ph; R: 6-EtNHCOCH₂O-5-I-(3-Pyridyl))
 10 FAB-MS (m/e) : 534 [M+H]⁺

実施例3351 (R¹:H; R²:H; R³:i-Pr; R⁴:H; R⁶:H; Z:
 Ph; R: 4-EtNHCOCH₂O-3-NO₂-Ph)
 FAB-MS (m/e) : 452 [M+H]⁺

15 実施例3412 (R¹:H; R²:H; R³:i-Pr; R⁴:H; R⁶:Me;
 Z: Ph; R: 3-C1-4-EtNHCOCH₂O-Ph)
 FAB-MS (m/e) : 455 [M+H]⁺

20 実施例3418 (R¹:H; R²:H; R³:i-Pr; R⁴:H; R⁶:Et;
 Z: Ph; R: 4-EtNHCOCH₂O-3-Me-Ph)
 FAB-MS (m/e) : 449 [M+H]⁺

25 実施例3464 (R¹:H; R²:H; R³:i-Pr; R⁴:H; R⁶:H; Z:
 pyrimidin-4, 5-yl; R: 4-n-BuNHCOCH₂O-Ph)
 FAB-MS (m/e) : 437 [M+H]⁺

実施例3472 (R¹:H; R²:H; R³:i-Pr; R⁴:H; R⁶:H; Z:
 Ph; R: 3-C1-4-HO-Ph)

¹HNMR (CDCl₃) δ : 0. 88 (3H, d, J=6. 7Hz), 1. 11 (3H, d, J=6. 7Hz), 1. 53–1. 65 (1H, m), 2. 55 (1H, d, J=17. 5Hz), 3. 54 (1H, d, J=17. 5Hz), 4. 01 (1H, d, J=9. 5Hz), 6. 98 (1H, d, J=8. 6Hz), 5 7. 10–7. 20 (1H, m), 7. 13 (1H, dd, J=2. 3, 8. 6Hz), 7. 27 (1H, d, J=2. 3Hz), 7. 47–7. 57 (2H, m), 7. 91–7. 94 (1H, m)
FAB-MS (m/e) : 356 [M+H]⁺

10 実施例3473 (R¹:H; R²:H; R³:i-Pr; R⁴:H; R⁶:H; Z:Ph; R:4-HO-3-Me-Ph)

¹HNMR (CDCl₃) δ : 0. 86 (3H, d, J=6. 6Hz), 1. 08 (3H, d, J=6. 6Hz), 1. 53–1. 61 (3H, m), 2. 20 (3H, s), 2. 50 (1H, d, J=17. 3Hz), 3. 60 (1H, d, J=17. 3Hz), 4. 00 (1H, d, J=9. 7Hz), 5. 98 (1H, s), 6. 76 (1H, d, J=8. 2Hz), 6. 99 (1H, d, J=8. 2Hz), 7. 01 (1H, s), 7. 18 (1H, dd, J=1. 5, 6. 4Hz), 7. 44–7. 54 (2H, m), 7. 91 (1H, dd, J=1. 5, 6. 2Hz)

20 FAB-MS (m/e) : 336 [M+H]⁺

実施例3474 (R¹:H; R²:H; R³:i-Pr; R⁴:H; R⁶:H; Z:Ph; R:4-HO₂CCH₂O-3-Me-Ph)

¹HNMR (CDCl₃) δ : 0. 86 (3H, d, J=6. 6Hz), 1. 07 (3H, d, J=6. 6Hz), 1. 47–1. 59 (1H, m), 2. 19 (3H, s), 2. 52 (1H, d, J=17. 3Hz), 3. 58 (1H, d, J=17. 3Hz), 4. 00 (1H, d, J=9. 8Hz), 4. 60 (2H, s), 5. 99–6. 13 (1H, m), 6. 63 (1H, d, J=8. 3Hz), 7. 05–7. 17 (3H, m), 7. 44–7. 52 (2H, m), 7. 90–

7. 93 (1H, m)

FAB-MS (m/e) : 394 [M+H]⁺

- 実施例3475 (R¹:H; R²:H; R³:i-Pr; R⁴:H; R⁶:H; Z:
 5 Ph; R: 3, 5-C₁₂-4-n-PrNHC₂O-Ph)
¹HNMR (CDCl₃) δ: 0.94 (3H, d, J=6.4Hz), 0.98
 (3H, t, J=7.5Hz), 1.13 (3H, d, J=6.4Hz), 1.
 54-1.68 (3H, m), 2.63 (1H, d, J=16.1Hz), 3.
 35 (2H, q, J=6.6Hz), 3.50 (1H, d, J=16.1Hz),
 10 4.04 (1H, d, J=9.7Hz), 4.51 (2H, s), 6.93-6.
 94 (1H, m), 7.22-7.25 (1H, m), 7.33 (2H, s),
 7.51-7.61 (2H, m), 7.92-7.95 (1H, m)
 FAB-MS (m/e) : 489/491 [M+H]⁺
- 15 実施例3476 (R¹:H; R²:H; R³:i-Pr; R⁴:H; R⁶:H; Z:
 Ph; R: 3-Me-4-n-PrNHC₂O-Ph)
¹HNMR (CDCl₃) δ: 0.87 (3H, d, J=6.6Hz), 0.95
 (3H, t, J=7.5Hz), 1.09 (3H, d, J=6.6Hz), 1.
 51-1.75 (3H, m), 2.23 (3H, s), 2.54 (1H, d, J
 20 =17.4Hz), 3.59 (1H, d, J=17.4Hz), 3.71 (2H,
 q, J=6.6Hz), 4.01 (1H, d, J=9.8Hz), 4.88 (2
 H, s), 6.74 (1H, d, J=8.2Hz), 7.09 (1H, d, J=
 2.2Hz), 7.14-7.17 (2H, m), 7.46-7.54 (2H,
 m), 7.91-7.93 (1H, m), 8.19-8.21 (1H, m)
 25 FAB-MS (m/e) : 451 [M+H]⁺

実施例3477 (R¹:H; R²:H; R³:i-Pr; R⁴:H; R⁶:H; Z:
 Ph; R: 3, 5-C₁₂-4-n-PrNHC₂O-Ph)

¹HNMR (CDCl₃) δ: 0.93 (3H, d, J=6.8Hz), 1.04

(3H, t, J=7. 4Hz), 1. 13 (3H, d, J=6. 8Hz), 1.
 32-1. 41 (1H, m), 1. 72-1. 81 (2H, m), 2. 62 (1
 H, d, J=17. 7Hz), 3. 51 (1H, d, J=17. 7Hz), 3.
 75 (2H, q, J=6. 6Hz), 4. 04 (1H, d, J=9. 7Hz),
 5 4. 89 (2H, s), 7. 22 (1H, d, J=7. 9Hz), 7. 33 (2
 H, s), 7. 52-7. 69 (2H, m), 7. 93-7. 95 (1H, m),
 8. 69-8. 71 (1H, m)

FAB-MS (m/e) : 505/507 [M+H] +

- 10 実施例3478 (R¹:H; R²:H; R³:i-Pr; R⁴:H; R⁶:H; Z:
 Ph; R:4-n-Pentyl-NHCOCH₂O-Ph)
¹HNMR (CDCl₃) δ: 0. 83-0. 96 (3H, m), 0. 87 (3H,
 d, J=6. 7Hz), 1. 10 (3H, d, J=6. 7Hz), 1. 14-1.
 70 (7H, m), 2. 56 (1H, d, J=17. 2Hz), 3. 32 (2H,
 15 q, J=6. 6Hz), 3. 60 (1H, d, J=17. 2Hz), 4. 02 (1
 H, d, J=9. 6Hz), 4. 46 (2H, s), 6. 49 (1H, s), 6.
 87 (2H, d, J=9. 0Hz), 7. 15-7. 20 (1H, m), 7. 2
 5-7. 34 (2H, m), 7. 48-7. 54 (2H, m), 7. 91-7.
 92 (1H, m)
- 20 FAB-MS (m/e) : 449 [M+H] +

- 実施例3479 (R¹:H; R²:H; R³:i-Pr; R⁴:H; R⁶:Me;
 Z:Ph; R:4-MeO-Ph)
¹HNMR (CDCl₃) δ: 0. 69 (3H, d, J=7. 5Hz), 0. 91
 25 (3H, d, J=6. 7Hz), 1. 11 (3H, d, J=6. 7Hz), 1.
 48-1. 73 (1H, m), 3. 51 (1H, q, J=7. 5Hz), 3. 7
 7 (3H, s), 4. 02 (1H, d, J=9. 6Hz), 6. 83 (2H, d,
 J=8. 9Hz), 7. 10-7. 13 (1H, m), 7. 24 (2H, d, J
 =8. 9Hz), 7. 46-7. 51 (2H, m), 7. 89-7. 99 (1H,

m)

FAB-MS (m/e) : 350 [M+H]⁺

実施例3480 (R¹:H; R²:H; R³:i-Pr; R⁴:H; R⁶:Me;
5 Z:Ph; R:4-HO-Ph)

¹HNMR (CDCl₃) δ: 0.68 (3H, d, J=7.5Hz), 0.89
(3H, d, J=6.6Hz), 1.10 (3H, d, J=6.6Hz), 1.
48-1.69 (1H, m), 3.52 (1H, q, J=7.5Hz), 4.0
2 (1H, dd, J=1.0, 9.5Hz), 5.63 (1H, s), 6.79
10 (2H, d, J=8.8Hz), 7.11-7.15 (1H, m), 7.18 (2
H, d, J=8.8Hz), 7.44-7.54 (2H, m), 7.90-7.
92 (1H, m)

FAB-MS (m/e) : 336 [M+H]⁺

15 実施例3481 (R¹:H; R²:H; R³:i-Pr; R⁴:H; R⁶:Me;
Z:Ph; R:4-n-PrNHC(=O)CH₂O-Ph)

¹HNMR (CDCl₃) δ: 0.70 (3H, d, J=7.6Hz), 0.90
(3H, d, J=7.4Hz), 0.90 (3H, d, J=6.6Hz), 1.
11 (3H, d, J=6.6Hz), 1.48-1.66 (3H, m), 3.3
0 (2H, q, J=6.8Hz), 3.50 (1H, q, J=7.5Hz), 4.
04 (1H, dd, J=1.0, 9.5Hz), 4.46 (2H, s), 6.5
0-6.51 (1H, m), 6.86 (2H, d, J=8.9Hz), 7.09-
7.12 (1H, m), 7.29 (2H, d, J=8.9Hz), 7.46-7.
52 (2H, m), 7.91-7.94 (1H, m)

25 FAB-MS (m/e) : 435 [M+H]⁺

実施例3482 (R¹:H; R²:H; R³:i-Pr; R⁴:H; R⁶:Br;
Z:Ph; R:4-n-PrNHC(=O)CH₂O-Ph)

¹HNMR (CDCl₃) δ: 0.90 (3H, d, J=6.6Hz), 0.99

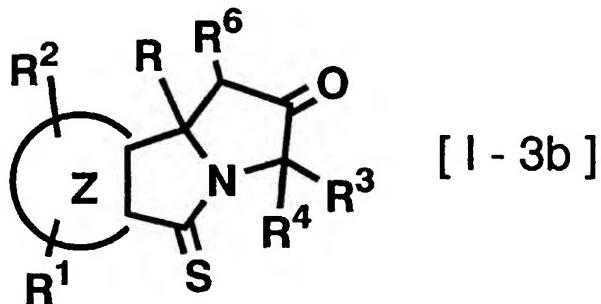
(3H, t, J=6.6 Hz), 1.17 (3H, d, J=6.6 Hz), 1.51-1.74 (3H, m), 3.30 (2H, q, J=6.7 Hz), 4.36 (1H, d, J=9.5 Hz), 4.47 (2H, s), 5.14 (1H, s), 6.47-6.50 (1H, m), 6.91 (2H, d, J=8.9 Hz), 7.51 16-7.19 (1H, m), 7.34 (2H, d, J=8.9 Hz), 7.50-7.57 (2H, m), 7.91-7.94 (1H, m)
FAB-MS (m/e) : 499/501 [M+H]⁺

実施例3485 (R¹:H; R²:H; R³:i-Pr; R⁴:H; R⁶:MeS
10 O₂NHC₂CH₂; Z:Ph; R:4-n-PrNHCOCH₂O-Ph)
FAB-MS (m/e) : 542 [M+H]⁺

実施例3486 (R¹:H; R²:H; R³:i-Pr; R⁴:H; R⁶:MeO₂
CCH₂; Z:Ph; R:4-n-PrNHCOCH₂O-Ph)
15 FAB-MS (m/e) : 493 [M+H]⁺

実施例3487 (R¹:H; R²:H; R³:i-Pr; R⁴:H; R⁶:HOCH₂
H₂CH₂; Z:Ph; R:4-n-PrNHCOCH₂O-Ph)
FAB-MS (m/e) : 465 [M+H]⁺

20

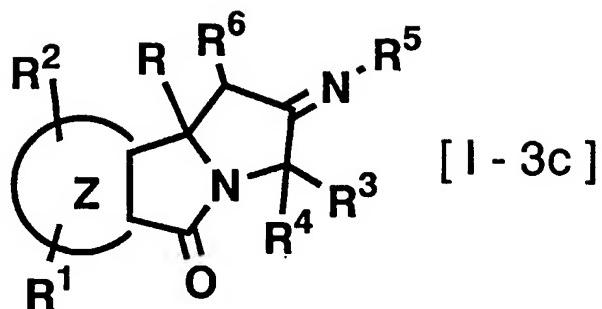


実施例3488 (R¹:H; R²:H; R³:i-Pr; R⁴:H; R⁶:H; Z:
Ph; R:3, 5-C₁₂-4-n-PrNHCOCH₂O-Ph)

¹HNMR (CDCl₃) δ : 0. 98 (3H, t, J=7. 4Hz), 1. 03
 (3H, d, J=6. 6Hz), 1. 15 (3H, d, J=6. 6Hz), 1.
 52-1. 67 (3H, m), 2. 61 (1H, d, J=18. 0Hz), 3.
 35 (2H, q, J=6. 6Hz), 3. 55 (1H, d, J=18. 0Hz),
 5 4. 51 (2H, s), 4. 57 (1H, d, J=10. 4Hz), 6. 89-
 6. 93 (1H, m), 7. 53-7. 61 (2H, m), 8. 12-8. 15
 (1H, m)
 FAB-MS (m/e) : 505/507 [M+H]⁺

10 実施例3489 (R¹:H; R²:H; R³:i-Pr; R⁴:H; R⁶:H; Z:
 Ph; R:3, 5-C1₂-4-n-PrNHCSCH₂O-Ph)
¹HNMR (CDCl₃) δ : 1. 02 (3H, d, J=6. 3Hz), 1. 04
 (3H, t, J=7. 4Hz), 1. 14 (3H, d, J=6. 3Hz), 1.
 52-1. 59 (1H, m), 1. 71-1. 83 (2H, m), 2. 61 (1
 15 H, d, J=17. 5Hz), 3. 56 (1H, d, J=17. 5Hz), 3.
 75 (2H, q, J=6. 6Hz), 4. 56 (1H, d, J=10. 3Hz),
 4. 90 (2H, s), 7. 17-7. 20 (1H, m), 7. 23 (2H, s),
 7. 53-7. 60 (2H, m), 8. 12-8. 15 (1H, m)
 FAB-MS (m/e) : 521/523/525 [M+H]⁺

20 実施例3492 (R¹:H; R²:H; R³:i-Pr; R⁴:H; R⁶:H; Z:
 pyrimidin-4, 5-yl; R:4-n-BuNHCOCH₂O-Ph)
 FAB-MS (m/e) : 453 [M+H]⁺



実施例 3499 (R^1 : H; R^2 : H; R^3 : i-Pr; R^4 : H; R^5 : MeO;
 R^6 : H; Z: Ph; R: 3-Me-4-n-Pr NHCOCH₂O-Ph)

5 幾何異性体A

¹HNMR (CDCl₃) δ : 0. 92 (3H, t, J=7. 5Hz), 0. 93
(3H, d, J=6. 6Hz), 1. 06 (3H, d, J=6. 6Hz), 1.
46-1. 71 (3H, m), 2. 22 (3H, s), 2. 63 (1H, d, J
=18. 1Hz), 3. 31 (2H, q, J=6. 7Hz), 3. 88 (3H,
10 s), 3. 93 (1H, dd, J=1. 0, 18. 1Hz), 4. 38 (1H,
d, J=9. 9Hz), 4. 47 (2H, s), 6. 50-6. 52 (1H, m),
6. 72 (1H, d, J=8. 5Hz), 7. 11 (1H, d, J=2. 4Hz),
7. 11-7. 13 (1H, m), 7. 21 (1H, dd, J=2. 4, 8. 5
Hz), 7. 39-7. 49 (2H, m), 7. 81-7. 84 (1H, m)
15 FAB-MS (m/e) : 464 [M+H]⁺

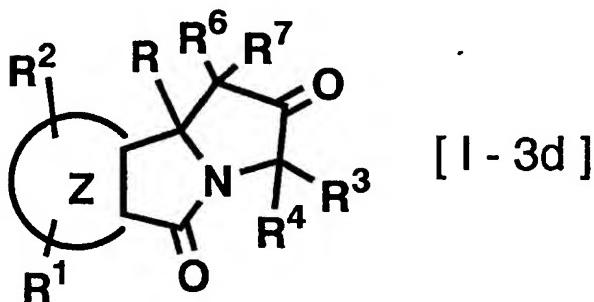
幾何異性体B

¹HNMR (CDCl₃) δ : 0. 59 (3H, d, J=6. 8Hz), 0. 92
(3H, t, J=7. 4Hz), 0. 97 (3H, d, J=6. 8Hz), 1.
52-1. 61 (2H, m), 2. 04-2. 12 (1H, m), 2. 23 (3
20 H, s), 2. 90 (1H, d, J=17. 3Hz), 3. 29 (2H, q, J
=6. 7Hz), 3. 71 (1H, dd, J=1. 5, 17. 3Hz), 3. 7
9 (3H, s), 4. 46 (2H, s), 4. 91 (1H, dd, J=1. 2,
7. 6Hz), 6. 50-6. 51 (1H, m), 6. 73 (1H, d, J=8.
5Hz), 7. 11-7. 13 (1H, m), 7. 14 (1H, d, J=2. 4

Hz), 7.23 (1H, dd, J=2.4, 8.5 Hz), 7.37-7.50 (2H, m), 7.79-7.82 (1H, m)
FAB-MS (m/e) : 464 [M+H]⁺

5 実施例3500 (R¹:H; R²:H; R³:i-Pr; R⁴:H; R⁵:HO;
R⁶:H; Z:Ph; R:3-C1-4-n-PrNHCOCH₂O-Ph)
FAB-MS (m/e) : 470 [M+H]⁺

実施例3501 (R¹:H; R²:H; R³:i-Pr; R⁴:H; R⁵:Me;
10 R⁶:H; Z:Ph; R:4-n-PrNHCOCH₂O-Ph)
FAB-MS (m/e) : 434 [M+H]⁺



15 実施例3509 (R¹:H; R²:H; R³:i-Pr; R⁴:H; R⁵:Me;
R⁶:Me; Z:Ph; R:4-MeO-Ph)
¹HNMR (CDCl₃) δ: 0.52 (3H, s), 1.01 (3H, d, J=6.6 Hz), 1.29 (3H, d, J=6.6 Hz), 1.44 (3H, s), 1.85-1.99 (1H, m), 3.77 (3H, s), 4.01 (1H, d, J=10.3 Hz), 6.78 (2H, d, J=9.1 Hz), 7.14 (2H, d, J=9.1 Hz), 7.47-7.66 (3H, m), 7.92-7.95 (1H, m)
FAB-MS (m/e) : 364 [M+H]⁺

実施例 3510 ($R^1 : H ; R^2 : H ; R^3 : i-Pr ; R^4 : H ; R^6 : Me$;
 $R^7 : Me$; $Z : Ph$; $R : 4-HO-Ph$)

1H NMR ($CDCl_3$) δ : 0. 50 (3H, s), 0. 97 (3H, d, $J = 6. 6$ Hz), 1. 28 (3H, d, $J = 6. 6$ Hz), 1. 44 (3H, s),
5 1. 83 – 1. 91 (1H, m), 4. 01 (1H, d, $J = 10. 3$ Hz), 5. 91 – 5. 92 (1H, m), 6. 74 (2H, d, $J = 8. 9$ Hz), 7. 04 (2H, d, $J = 8. 9$ Hz), 7. 47 (1H, d, $J = 7. 5$ Hz),
7. 93 (1H, d, $J = 7. 5$ Hz)

FAB-MS (m/e) : 350 [M+H]⁺

10

実施例 3511 ($R^1 : H ; R^2 : H ; R^3 : i-Pr ; R^4 : H ; R^6 : Me$;
 $R^7 : Me$; $Z : Ph$; $R : 4-n-PrNHCOCH_2O-Ph$)

1H NMR ($CDCl_3$) δ : 0. 50 (3H, s), 0. 90 (3H, t, $J = 7. 4$ Hz), 1. 02 (3H, d, $J = 6. 5$ Hz), 1. 30 (3H, d,
15 $J = 6. 5$ Hz), 1. 43 (3H, s), 1. 51 – 1. 58 (2H, m), 1. 85 – 1. 89 (1H, m), 3. 29 (2H, q, $J = 6. 8$ Hz), 4. 02 (1H, d, $J = 10. 4$ Hz), 4. 45 (2H, s), 6. 49 – 6. 50 (1H, m), 6. 82 (2H, d, $J = 9. 0$ Hz), 7. 20 (2H, d, $J = 9. 0$ Hz), 7. 47 – 7. 67 (3H, m), 7. 93 – 7. 95
20 (1H, m)

FAB-MS (m/e) : 449 [M+H]⁺

実施例 3515 ($R^1 : H ; R^2 : H ; R^3 : i-Pr ; R^4 : H ; R^6 : MeC$
 OCH_2 ; $R^7 : Me$; $Z : Ph$; $R : 4-n-PrNHCOCH_2O-Ph$)
25 FAB-MS (m/e) : 491 [M+H]⁺

実施例 3516 ($R^1 : H ; R^2 : H ; R^3 : i-Pr ; R^4 : H ; R^6 : MeO_2$
 CCH_2 ; $R^7 : Me$; $Z : Ph$; $R : 4-n-PrNHCOCH_2O-Ph$)
FAB-MS (m/e) : 507 [M+H]⁺

実施例 4002

3-(1-メチルエチル)-9b-フェニル[1, 3]チアゾロ[2, 3-a]

イソインドール-2, 5(3H, 9bH)-ジオン (一般式 [I-4]において、
 $R^1 : H$; $R^2 : H$; $R^3 : i-Pr$; $R^4 : H$; $Z : Ph$; $R : Ph$ の化合物)

- 5 2-ベンゾイル安息香酸 5. 0 g (22. 1 mmol)、D-バリンメチルエステル塩酸塩 4. 1 g (24. 3 mmol) 及びトリエチルアミン 9. 2 ml (66. 3 mmol) の塩化メチレン溶液 250 ml に、氷冷下、1-ヒドロキシベンゾトリアゾール水和物 3. 6 g (26. 5 mmol) と 1-(3-ジメチルアミノプロピル)-3-エチルカルボジイミド塩酸塩 5. 1 g (26. 5 mmol) 10 を加え、反応溶液を室温で 3 時間攪拌した。反応溶液に飽和塩化アンモニウム水溶液を添加し、クロロホルムで抽出後、有機層を飽和食塩水溶液で洗浄し、乾燥し、減圧下に濃縮した。得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(ヘキサン：酢酸エチルエステル=1:1)により精製し、縮合生成物 4. 9 g (収率：65%)を得た。得られた縮合生成物 212 mg (0. 62 mmol) のテ
- 15 15 トライドロフラン溶液 (4. 5 ml) に水硫化ナトリウム n 水和物 140 mg (2. 50 mmol) を加え、反応溶液を室温で 12 時間攪拌した後、反応溶液に室温で 1 N 塩酸水溶液を添加した。酢酸エチルエステルで抽出し、有機層を乾燥し、減圧下に濃縮し得られた未精製のチオカルボン酸を塩化メチレン 2. 5 ml に溶解した。反応溶液に室温でトリフルオロ酢酸 2. 5 ml を加え、室温で 30 分間 20 攪拌した後、減圧下に濃縮した。得られた残渣をトルエンで共沸を 3 回繰り返し、減圧下に濃縮した。得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(ヘキサン：酢酸エチルエステル=2:1)により精製し、表題化合物のジアステレオマー A 43. 0 mg (収率：21%) を無色油状物として、ジアステレオマー B 7. 0 mg (収率：4%) を無色油状物として得た。

- 25 ジアステレオマー A

^1H NMR (CDCl_3) δ : 1. 14 (3H, d, $J = 6. 7 \text{ Hz}$) , 1. 31 (3H, d, $J = 6. 7 \text{ Hz}$) , 3. 61-3. 71 (1H, m) , 3. 81 (1H, dd, $J = 0. 7, 4. 6 \text{ Hz}$) , 7. 31-7. 60 (8H, m) , 7. 91 (1H, dd, $J = 2. 7, 7. 9 \text{ Hz}$)

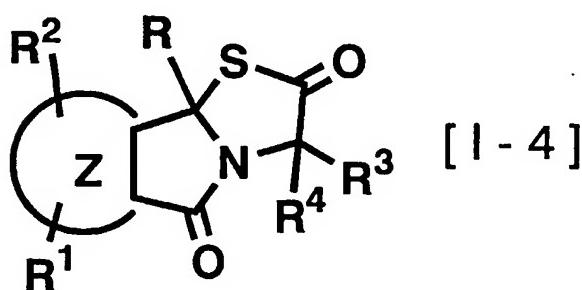
FAB-MS (m/e) : 324 [M+H]⁺

ジアステレオマーB

¹HNMR (CDCl₃) δ : 0.85 (3H, d, J=6.6Hz), 1.05
 (3H, d, J=6.6Hz), 1.51-1.62 (1H, m), 4.53 (1
 5 H, d, J=10.3Hz), 7.14-7.17 (1H, m), 7.30-7.
 98 (8H, m)

FAB-MS (m/e) : 324 [M+H]⁺

実施例4002と同様にして、前記の化合物リストの一般式 [I-4] の化合物の化合物番号に対応する実施例4007、4011、4024、4061、4063、4073、4074、4079、4087、7092、4113、4410、4419及び4424の化合物を得た。以下にこれらの物理定数を示す。



15

実施例4007 (R¹:H; R²:H; R³:i-Pr; R⁴:H; Z:Ph; R:
 4-HO-Ph)

¹HNMR (CDCl₃) δ : 0.85 (3H, d, J=6.6Hz), 1.07
 (3H, d, J=6.7Hz), 1.52-1.64 (1H, m), 4.50 (1
 20 H, d, J=10.4Hz), 5.11 (1H, brs), 6.79 (2H, d,
 J=8.8Hz), 7.15-7.17 (1H, m), 7.32 (2H, d, J
 =8.8Hz), 7.51-7.57 (2H, m), 7.94-7.97 (1H,
 m)

FAB-MS (m/e) : 340 [M+H]⁺

実施例4011 (R¹:H; R²:H; R³:i-Pr; R⁴:H; Z:Ph; R:
4-MeO-Ph)

¹HNMR (CDCl₃) δ: 0.85 (3H, d, J=6.1Hz), 1.07
(3H, d, J=6.7Hz), 1.52-1.64 (1H, m), 3.81 (3
5 H, s), 4.50 (1H, d, J=10.4Hz), 6.85 (2H, d, J
=9.0Hz), 7.14-7.17 (1H, m), 7.36 (2H, d, J
=9.0Hz), 7.51-7.57 (2H, m), 7.94-7.97 (1H,
m)

FAB-MS (m/e) : 354 [M+H]⁺

10

実施例4024 (R¹:H; R²:H; R³:i-Pr; R⁴:H; Z:Ph; R:
4-n-PrNHCOC₂O-Ph)

¹HNMR (CDCl₃) δ: 0.84 (3H, d, J=6.6Hz), 0.91
(3H, t, J=7.4Hz), 1.07 (3H, d, J=6.7Hz), 1.
15 5.0-1.62 (3H, m), 3.31 (2H, q, J=7.0Hz), 4.4
8 (2H, s), 4.51 (1H, d, J=10.4Hz), 6.54 (1H,
brs), 6.89 (2H, d, J=9.0Hz), 7.13-7.16 (1H,
m), 7.41 (2H, d, J=9.0Hz), 7.52-7.59 (2H, m),
7.95-7.98 (1H, m)

20 FAB-MS (m/e) : 439 [M+H]⁺

実施例4061 (R¹:H; R²:H; R³:i-Pr; R⁴:H; Z:Ph; R:
4-HO-3-I-Ph)

¹HNMR (CDCl₃) δ: 0.89 (3H, d, J=6.6Hz), 1.08
(3H, d, J=6.8Hz), 1.52-1.64 (1H, m), 4.50 (1
H, d, J=10.4Hz), 5.70 (1H, brs), 6.94 (1H, d,
J=8.6Hz), 7.14-7.19 (1H, m), 7.30 (1H, dd,
J=2.4, 8.6Hz), 7.53-7.62 (2H, m), 7.77 (1H,
d, J=2.4Hz), 7.95-7.98 (1H, m)

FAB-MS (m/e) : 466 [M+H]⁺

実施例4063 (R¹:H; R²:H; R³:i-Pr; R⁴:H; Z:Ph; R:
3-I-4-MeO-Ph)

- 5 ¹HNMR (CDCl₃) δ: 0.89 (3H, d, J=6.6Hz), 1.08
(3H, d, J=6.9Hz), 1.52-1.64 (1H, m), 3.88 (3
H, s), 4.51 (1H, d, J=10.4Hz), 6.76 (1H, d, J
=8.6Hz), 7.16-7.18 (1H, m), 7.43 (1H, dd, J
=2.5, 8.6Hz), 7.55-7.59 (2H, m), 7.81 (1H,
10 d, J=2.5Hz), 7.95-7.98 (1H, m)

FAB-MS (m/e) : 480 [M+H]⁺

実施例4073 (R¹:H; R²:H; R³:i-Pr; R⁴:H; Z:Ph; R:
4-EtNHCOCH₂O-3-I-Ph)

- 15 ¹HNMR (CDCl₃) δ: 0.89 (3H, d, J=6.6Hz), 1.08
(3H, d, J=6.6Hz), 1.23 (3H, t, J=7.2Hz), 1.
50-1.58 (1H, m), 3.38-3.47 (2H, m), 4.45 (2
H, s), 4.52 (1H, d, J=10.7Hz), 6.73 (1H, d, J
=8.5Hz), 6.86 (1H, brs), 7.14-7.26 (1H, m),
20 7.47 (1H, dd, J=2.2, 8.5Hz), 7.56-7.59 (2H,
m), 7.84 (1H, d, J=2.2Hz), 7.96-7.99 (1H, m)
FAB-MS (m/e) : 551 [M+H]⁺

実施例4074 (R¹:H; R²:H; R³:i-Pr; R⁴:H; Z:Ph; R:
3-I-4-n-PrNHCOCH₂O-Ph)

¹HNMR (CDCl₃) δ: 0.89 (3H, d, J=6.6Hz), 0.98
(3H, t, J=7.4Hz), 1.08 (3H, d, J=6.6Hz), 1.
50-1.65 (3H, m), 3.36 (2H, q, J=7.0Hz), 4.5
1 (2H, s), 4.52 (1H, d, J=10.4Hz), 6.74 (1H,

d, J=8. 6Hz), 6. 91 (1H, brs), 7. 14-7. 17 (1H, m), 7. 48 (1H, dd, J=2. 4, 8. 6Hz), 7. 56-7. 60 (2H, m), 7. 85 (1H, d, J=2. 4Hz), 7. 96-7. 99 (1H, m)

5 FAB-MS (m/e) : 565 [M+H]⁺

実施例4079 (R¹:H; R²:H; R³:i-Pr; R⁴:H; Z:Ph; R:4-t-BuO₂CCH₂O-3-I-Ph)

¹HNMR (CDCl₃) δ: 0. 88 (3H, d, J=6. 6Hz), 1. 07 (3H, d, J=6. 6Hz), 1. 46 (9H, s), 1. 52-1. 64 (1H, m), 4. 50 (1H, d, J=10. 5Hz), 4. 57 (2H, s), 6. 62 (1H, d, J=8. 7Hz), 7. 15-7. 18 (1H, m), 7. 40 (1H, dd, J=2. 4, 8. 7Hz), 7. 55-7. 59 (2H, m), 7. 84 (1H, d, J=2. 4Hz), 7. 95-7. 98 (1H, m)

15 FAB-MS (m/e) : 580 [M+H]⁺

実施例4087 (R¹:H; R²:H; R³:i-Pr; R⁴:H; Z:Ph; R:4-HO₂CCH₂O-3-I-Ph)

¹HNMR (CDCl₃) δ: 0. 88 (3H, d, J=6. 0Hz), 1. 07 (3H, d, J=6. 6Hz), 1. 50-1. 58 (1H, m), 4. 51 (1H, d, J=10. 6Hz), 4. 73 (2H, s), 5. 93 (1H, brs), 6. 69 (1H, d, J=8. 5Hz), 7. 16-7. 19 (1H, m), 7. 42 (1H, dd, J=2. 2, 8. 5Hz), 7. 54-7. 61 (2H, m), 7. 85 (1H, d, J=2. 2Hz), 7. 96-7. 99 (1H, m)

25 FAB-MS (m/e) : 524 [M+H]⁺

実施例4092 (R¹:H; R²:H; R³:i-Pr; R⁴:H; Z:Ph; R:3-C1-4-n-PrNHCOCCH₂O-Ph)

¹HNMR (CDCl₃) δ: 0. 88 (3H, d, J=6. 6Hz), 0. 95

(3H, t, J=7.4Hz), 1.08 (3H, d, J=6.7Hz), 1.50-1.65 (3H, m), 3.34 (2H, q, J=6.9Hz), 4.52 (1H, d, J=10.3Hz), 4.53 (2H, s), 6.78 (1H, brs), 6.88 (1H, d, J=8.6Hz), 7.14-7.17 (1H, m), 7.39 (1H, dd, J=2.4, 8.6Hz), 7.50 (1H, d, J=2.4Hz), 7.56-7.62 (2H, m), 7.96-7.99 (1H, m)

FAB-MS (m/e) : 473 [M+H]⁺

10 実施例4113 (R¹:H; R²:H; R³:i-Pr; R⁴:H; Z:Ph; R:3,5-I₂-4-HO-Ph)

¹HNMR (CDCl₃) δ: 0.93 (3H, d, J=6.6Hz), 1.10 (3H, d, J=6.6Hz), 1.52-1.64 (1H, m), 4.51 (1H, d, J=10.6Hz), 7.18-7.21 (1H, m), 7.57-7.

15 62 (2H, m), 7.75 (2H, s), 7.96-7.99 (1H, m)

FAB-MS (m/e) : 592 [M+H]⁺

実施例4410 (R¹:H; R²:H; R³:i-Pr; R⁴:H; Z:4,5-pyridazinyl; R:4-n-PrNHCOCH₂O-Ph)

20 FAB-MS (m/e) : 441 [M+H]⁺

実施例4419 (R¹:H; R²:H; R³:i-Pr; R⁴:H; Z:Ph; R:4-n-PrNHCOCH₂O-pyrazin-2-yl)

FAB-MS (m/e) : 441 [M+H]⁺

25

実施例4424 (R¹:H; R²:H; R³:i-Pr; R⁴:H; Z:Ph; R:3-CI-4-HO-Ph)

¹HNMR (CDCl₃) δ: 0.88 (3H, d, J=6.6Hz), 1.08 (3H, d, J=6.6Hz), 1.52-1.64 (1H, m), 4.51 (1

H, d, J = 10. 3 Hz), 5. 72 (1H, br s), 6. 98 (1H, d, J = 8. 6 Hz), 7. 16 – 7. 19 (1H, m), 7. 24 (1H, dd, J = 2. 2, 8. 6 Hz), 7. 47 (1H, d, J = 2. 2 Hz), 7. 56 – 7. 59 (2H, m), 7. 95 – 7. 98 (1H, m)

5 FAB-MS (m/e) : 374 [M+H]⁺

(製剤化例)

以下に本発明の化合物の製剤化例を示すが、本発明の化合物の製剤化は、本製剤化例に限定されるものではない。

10

製剤化例 1

実施例 1002 の化合物 45 (部)

重質酸化マグネシウム 15

乳糖 75

15 を均一に混合して 350 μm 以下の粉末状又は細粒状の散剤とする。この散剤をカプセル容器に入れてカプセル剤とした。

製剤化例 2

実施例 3011 の化合物 45 (部)

20 濃粉 15

乳糖 16

結晶性セルロース 21

ポリビニルアルコール 3

蒸留水 30

25 を均一に混合した後、破碎造粒して乾燥し、次いで篩別して 141 ~ 177 μm の大きさの顆粒剤とした。

製剤化例 3

製剤化例 2 と同様の方法で顆粒剤を作った後、この顆粒剤 96 部に対してステ

アリン酸カルシウム4部を加えて圧縮成形し、直径10mmの錠剤を作製した。

製剤化例4

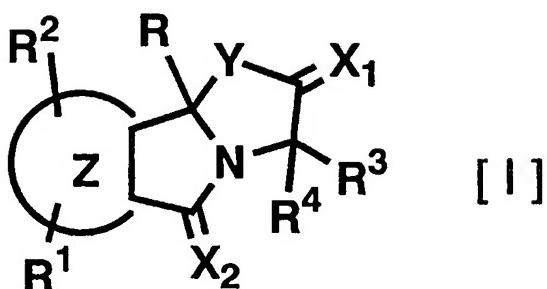
- 5 製剤化例2の方法で得られた顆粒剤の90部に対して結晶性セルロース10部及びステアリン酸カルシウム3部を加えて圧縮成形し、直径8mmの錠剤とした後、これにシロップゼラチン、沈降性炭酸カルシウム混合懸濁液を加えて糖衣錠を作製した。

産業上の利用可能性

- 10 本発明によれば、本発明化合物は、高い血中GLP-1濃度を呈する活性を示していることから、糖尿病治療剤、糖尿病の慢性合併症の予防剤又は抗肥満薬等を提供することができる。

請 求 の 範 囲

(1) 一般式 [I]



- 5 [式中、Rは、アジド基、アミノ基、カルバモイル基、カルバモイルアミノ基、カルバモイルオキシ基、カルボキシリル基、シアノ基、スルファモイル基、スルホ基、ニトロ基、ハロゲン原子、ヒドロキシ基、ホルミル基、ホルミルアミノ基、環状の飽和C₃—C₉脂肪族基、環状の不飽和C₃—C₉脂肪族基、アラルキル基、N—アラルキルアミノ基、N, N—ジアラルキルアミノ基、アラルキルオキシ基、アラルキルカルボニル基、N—アラルキルカルバモイル基、アリール基、N—アリールアミノ基、N, N—ジアリールアミノ基、アリールオキシ基、アリールスルホニル基、アリールスルホニルオキシ基、N—アリールスルホニルアミノ基、N—アリールスルホニルアミノC₁—C₁₀アルキルアミノ基、N—アリールスルホニルアミノC₁—C₁₀アルキルカルバモイル基、N—アリールスルホニルアミノC₁—C₆アルコキシカルボニル基、アリールスルファモイル基、アリールスルファモイルオキシ基、N—アリールスルファモイルC₁—C₁₀アルキルカルバモイル基、アリールスルファモイルC₁—C₆アルコキシカルボニル基、N—アリールカルバモイル基、アロイル基、アロキシ基、N—(N—アロイルアミノ)C₁—C₁₀アルキルカルバモイル基、N—アロイルアミノC₁—C₁₀アルコキシカルボニル基、C₂—C₆アルカノイル基、N—C₂—C₆アルカノイルアミノ基、N, N—ジ—C₂—C₆アルカノイルアミノ基、N—C₁—C₆アルキルアミノ基、N, N—ジ—C₁—C₆アルキルアミノ基、N—C₁—C₁₀アルキルカルバモイル基、N—C₁—C₁₀アルキルチオカルバモイル基、N, N—ジ—C₁—C₁₀アルキルカルバ

- モイル基、N, N-ジ-C₁-C₁₀アルキルチオカルバモイル基、N-C₂-C₆アルケニルカルバモイル基、N, N-ジ-C₂-C₆アルケニルカルバモイル基、N-アミノC₁-C₁₀アルキルカルバモイル基、N-C₁-C₆アルコキシC₁-C₁₀アルキルカルバモイル基、N-C₁-C₆アルコキシカルボニルC₁-C₁₀アル
- 5 キルカルバモイル基、N-C₁-C₆アルコキシカルボニルアミノC₁-C₁₀アルキルカルバモイル基、N-C₁-C₆アルコキシカルボニルアミノC₁-C₆アルコキシカルボニル基、C₁-C₆アルキルチオ基、N-C₁-C₆アルキルスルファモイル基、N, N-ジ-C₁-C₆アルキルスルファモイル基、C₁-C₆アルキルスルホニル基、N-C₁-C₆アルキルスルホニ
- 10 ルアミノ基、C₁-C₆アルコキシ基、C₁-C₆アルコキシカルボニル基、アミノC₁-C₆アルコキシカルボニル基、N-C₃-C₆シクロアルキルアミノ基、N, N-ジ-C₃-C₆シクロアルキルオキシ基、N-C₃-C₆シクロアルキルカルバモイル基及びN, N-ジ-C₃-C₆シクロアルキルカルバモイル基からなる群より選択される置換基、イソオキサゾリル基、
- 15 イソチアゾリル基、イミダゾリル基、オキサゾリル基、オキサジアゾリル基、チアゾリル基、チアジアゾリル基、チエニル基、トリアジニル基、トリアゾリル基、ピリジル基、ピラジニル基、ピリミジニル基、ピリダジニル基、ピラゾリル基、ピロリル基、ピラニル基、フリル基、フラザニル基、イミダゾリジニル基、イミダゾリニル基、テトラヒドロフラニル基、ピラゾリジニル基、ピラゾリニル基、
- 20 ピペラジニル基、ピペリジニル基、ピロリジニル基、ピロリニル基及びモルホリノ基からなる群より選択される5又は6員のヘテロ環基、アクリジニル基、イソキノリル基、イソインドリル基、インダゾリル基、インドリル基、インドリジニル基、エチレンジオキシフェニル基、カルバゾリル基、キナゾリニル基、キノキサリニル基、キノリジニル基、キノリル基、クマロニル基、クロメニル基、フェ
- 25 ナンスリジニル基、フェナンスロリニル基、ジベンゾフラニル基、ジベンゾチオフェニル基、シンノリニル基、チオナフテニル基、ナフチリジニル基、フェナジニル基、フェナキサジニル基、フェノチアジニル基、フタラジニル基、ブテリジニル基、ブリニル基、ベンゾイミダゾリル基、ベンゾオキサゾリル基、ベンゾチアゾリル基、ベンゾトリアゾリル基、ベンゾフラニル基及びメチレンジオキシフェ

ニル基からなる群より選択される窒素原子、酸素原子及び硫黄原子からなる群より選ばれるヘテロ原子を1環系当たり1ないし5個有する1ないし3環性の複素芳香環基並びに該ヘテロ環基又は該複素芳香環基が置換した、 $N-C_1-C_{10}$ アルキルカルバモイル基、 $N-C_1-C_{10}$ アルキルチオカルバモイル基、チオカルボニル基並びにカルボニル基からなる群から選択される置換基並びに該置換基で置換されていてもよい、直鎖の飽和 C_1-C_9 脂肪族基、直鎖の不飽和 C_1-C_9 脂肪族基、分枝鎖の飽和 C_1-C_9 脂肪族基、分枝鎖の不飽和の C_1-C_9 脂肪族基、 C_1-C_6 アルコキシ基、 C_1-C_6 アルキルチオ基及び $N-C_1-C_6$ アルキルアミノ基からなる群より選択される置換基からなる群より選択される置換基を1又は5
10 それ以上有していてもよい、アリール基、アセナフチレニル基、アダマンチル基、アンスリル基、インデニル基、ノルボルニル基及びフェナンスリル基からなる群より選択される1ないし3環性の C_7-C_{15} 炭素芳香環基又はイソオキサゾリル基、イソチアゾリル基、イミダゾリル基、オキサゾリル基、オキサジアゾリル基、チアゾリル基、チアジアゾリル基、チエニル基、トリアジニル基、トリアゾリル基、ピリジル基、ピラジニル基、ピリミジニル基、ピリダジニル基、ピラゾリル基、ピロリル基、ピラニル基、フリル基、フラザニル基、イミダゾリジニル基、イミダゾリニル基、テトラヒドロフラニル基、ピラゾリジニル基、ピラゾリニル基、ピペラジニル基、ピペリジニル基、ピロリジニル基、ピロリニル基及びモルホリノ基からなる群より選択される5又は6員のヘテロ環基若しくはアクリジニル基、イソキノリル基、イソインドリル基、インダゾリル基、インドリル基、イントリジニル基、エチレンジオキシフェニル基、カルバゾリル基、キナゾリニル基、キノキサリニル基、キノリジニル基、キノリル基、クマロニル基、クロメニル基、フェナンスリジニル基、フェナンスロリニル基、ジベンゾフラニル基、ジベンゾチオフェニル基、シンノリニル基、チオナフテニル基、ナフチリジニル基、25 フェナジニル基、フェナキサジニル基、フェノチアジニル基、フタラジニル基、ブテリジニル基、ブリニル基、ベンゾイミダゾリル基、ベンゾオキサゾリル基、ベンゾチアゾリル基、ベンゾトリアゾリル基、ベンゾフラニル基及びメチレンジオキシフェニル基からなる群より選択される窒素原子、酸素原子及び硫黄原子からなる群より選ばれるヘテロ原子を1環系当たり1ないし5個有する1ないし3

環性の複素芳香環基、R¹及びR²は、同一又は異なって、水素原子、アジド基、アミノ基、カルバモイル基、カルバモイルアミノ基、カルバモイルオキシ基、カルボキシル基、シアノ基、スルファモイル基、スルホ基、ニトロ基、ハロゲン原子、ヒドロキシ基、ホルミル基、ホルミルアミノ基、環状の飽和C₃—C₉脂肪族基、環状の不飽和C₃—C₉脂肪族基、アラルキル基、N—アラルキルアミノ基、アラルキルオキシ基、アラルキルカルボニル基、アリール基、N—アリールアミノ基、アリールオキシ基、アリールスルホニル基、N—アリールスルホニルアミノ基、N—アリールスルホニルアミノC₁—C₁₀アルキルアミノ基、N—アリールスルホニルアミノC₁—C₁₀アルキルカルバモイル基、N—アリールスルホニルアミノC₁—C₆アルコキシカルボニル基、C₂—C₆アルカノイル基、N—C₂—C₆アルカノイルアミノ基、アロイル基、N—アロイルアミノ基、N—アロイルC₁—C₁₀アルキルカルバモイル基、N—C₁—C₆アルキルアミノ基、N，N—ジ—C₁—C₆アルキルアミノ基、N—C₁—C₁₀アルキルカルバモイル基、N，N—ジ—C₁—C₁₀アルキルカルバモイル基、N—C₁—C₆アルキルスルファモイル基、C₁—C₆アルキルスルフィニル基、C₁—C₆アルキルスルホニル基、N—C₁—C₆アルキルスルホニルアミノ基、C₁—C₆アルキルチオ基、C₁—C₆アルコキシ基、C₁—C₆アルコキシカルボニル基、N—C₃—C₆シクロアルキルアミノ基、C₃—C₆シクロアルキルオキシ基及びN—C₃—C₆シクロアルキルカルバモイル基からなる群から選択される置換基又は該置換基で置換されていてもよい、直鎖の飽和C₁—C₉脂肪族基、直鎖の不飽和C₁—C₉脂肪族基、分枝鎖の飽和C₁—C₉脂肪族基、分枝鎖の不飽和のC₁—C₉脂肪族基、N—C₁—C₆アルキルアミノ基、C₁—C₆アルキルチオ基若しくはC₁—C₆アルコキシ基、R³及びR⁴は、同一又は異なって、水素原子、アジド基、アミジノ基、アミノ基、カルバモイル基、カルバモイルアミノ基、カルバモイルオキシ基、カルボキシル基、グアニジノ基、シアノ基、スルファモイル基、スルホ基、ニトロ基、ハロゲン原子、ヒドロキシ基、ホルミル基、ホルミルアミノ基、環状の飽和C₃—C₉脂肪族基、環状の不飽和C₃—C₉脂肪族基、C₂—C₆アルカノイル基、N—C₂—C₆アルカノイルアミノ基、N—C₁—C₆アルキルアミノ基、N，N—ジ—C₁—C₆アルキルアミノ基、N—C₁—C₁₀アルキ

ルカルバモイル基、N, N-ジ-C₁-C₁₀アルキルカルバモイル基、C₁-C₆アルキルチオ基、N-C₁-C₆アルキルスルファモイル基、C₁-C₆アルキルスルフィニル基、C₁-C₆アルキルスルホニル基、N-C₁-C₆アルキルスルホニルアミノ基、C₁-C₆アルコキシ基、C₁-C₆アルコキシカルボニル基、N-C₃-C₆シクロアルキルアミノ基、C₃-C₆シクロアルキルオキシ基及びN-C₃-C₆シクロアルキルカルバモイル基からなる群から選択される置換基、該置換基で置換されていてもよい、直鎖の飽和C₁-C₉脂肪族基、直鎖の不飽和C₁-C₉脂肪族基、分枝鎖の飽和C₁-C₉脂肪族基及び分枝鎖の不飽和のC₁-C₉脂肪族基からなる群から選択される置換基、アジド基、アミノ基、カルバモイル基、
 10 カルバモイルアミノ基、カルバモイルオキシ基、カルボキシル基、シアノ基、スルファモイル基、スルホ基、ニトロ基、ハロゲン原子、ヒドロキシ基、ホルミル基、ホルミルアミノ基、環状の飽和C₃-C₉脂肪族基、環状の不飽和C₃-C₉脂肪族基、アラルキル基、N-アラルキルアミノ基、N, N-ジアラルキルアミノ基、アラルキルオキシ基、アラルキルカルボニル基、N-アラルキルカルバモイル基、アリール基、アリール基、N-アリールアミノ基、N, N-ジアリールアミノ基、アリールオキシ基、アリールスルホニル基、アリールスルホニルオキシ基、N-アリールスルホニルアミノ基、N-アリールスルホニルアミノC₁-C₁₀アルキルアミノ基、N-アリールスルホニルアミノC₁-C₆アルコキシカルボニル基、アリールスル
 20 ファモイル基、アリールスルファモイルオキシ基、N-アリールスルファモイルC₁-C₁₀アルキルカルバモイル基、アリールスルファモイルC₁-C₆アルコキシカルボニル基、N-アリールカルバモイル基、アロイル基、アロキシ基、N-(N-アロイルアミノ)C₁-C₁₀アルキルカルバモイル基、N-アロイルアミノC₁-C₁₀アルコキシカルボニル基、C₂-C₆アルカノイル基、N-C₂-C₆
 25 アルカノイルアミノ基、N, N-ジ-C₂-C₆アルカノイルアミノ基、N-C₁-C₆アルキルアミノ基、N, N-ジ-C₁-C₆アルキルチオアミノ基、N-C₁-C₁₀アルキルカルバモイル基、N, N-ジ-C₁-C₁₀アルキルカルバモイル基、N, N-ジ-C₁-C₁₀アルキルチオカルバモイル基、N-C₂-C₆アルケニルカルバモイル基、N, N-ジ-C₂-C₆

アルケニルカルバモイル基、N—アミノC₁—C₁₀アルキルカルバモイル基、N—C₁—C₆アルコキシC₁—C₁₀アルキルカルバモイル基、N—C₁—C₆アルコキシカルボニルC₁—C₁₀アルキルカルバモイル基、N—C₁—C₆アルコキシカルボニルアミノC₁—C₁₀アルキルカルバモイル基、N—C₁—C₆アルコキシカルボニルアミノC₁—C₆アルコキシカルボニル基、C₁—C₆アルキルチオ基、N—C₁—C₆アルキルスルファモイル基、N, N—ジーC₁—C₆アルキルスルファモイル基、C₁—C₆アルキルスルフィニル基、C₁—C₆アルキルスルホニル基、N—C₁—C₆アルキルスルホニルアミノ基、C₁—C₆アルコキシ基、C₁—C₆アルコキシカルボニル基、アミノC₁—C₆アルコキシカルボニル基、N—C₃—C₆シクロアルキルアミノ基、N, N—ジーC₃—C₆シクロアルキルアミノ基、C₃—C₆シクロアルキルオキシ基、N—C₃—C₆シクロアルキルカルバモイル基及びN, N—ジーC₃—C₆シクロアルキルカルバモイル基からなる群より選択される置換基、イソオキサゾリル基、イソチアゾリル基、イミダゾリル基、オキサゾリル基、オキサジアゾリル基、チアゾリル基、チアジアゾリル基、チエニル基、トリアジニル基、トリアゾリル基、ピリジル基、ピラジニル基、ピリミジニル基、ピリダジニル基、ピラゾリル基、ピロリル基、ピラニル基、フリル基、フラザニル基、イミダゾリジニル基、イミダゾリニル基、テトラヒドロフラニル基、ピラゾリジニル基、ピラゾリニル基、ピペラジニル基、ピペリジニル基、ピロリジニル基、ピロリニル基及びモルホリノ基からなる群より選択される5又は6員のヘテロ環基、アクリジニル基、イソキノリル基、イソインドリル基、インダゾリル基、インドリル基、インドリジニル基、エチレンジオキシフェニル基、カルバゾリル基、キナゾリニル基、キノキサリニル基、キノリジニル基、キノリル基、クマロニル基、クロメニル基、フェナンスリジニル基、フェナンスロリニル基、ジベンゾフラニル基、ジベンゾチオフェニル基、シンノリニル基、チオナフテニル基、ナフチリジニル基、フェナジニル基、フェナキサジニル基、フェノチアジニル基、フタラジニル基、ブテリジニル基、ブリニル基、ベンゾイミダゾリル基、ベンゾオキサゾリル基、ベンゾチアゾリル基、ベンゾトリアゾリル基、ベンゾフラン基及びメチレンジオキシフェニル基からなる群より選択される窒素原子、酸素原子及び硫黄原子からなる群より選ばれるヘテロ原子を1環系当たり1ない

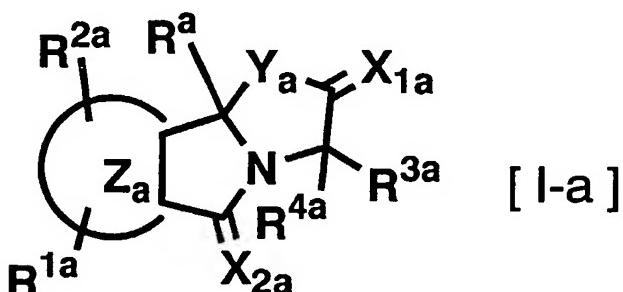
し 5 個有する 1 ないし 3 環性の複素芳香環基並びに該ヘテロ環基又は該複素芳香環基が置換した、 $N-C_1-C_{10}$ アルキルカルバモイル基、 $N-C_1-C_{10}$ アルキルチオカルバモイル基、チオカルボニル基並びにカルボニル基からなる群から選択される置換基並びに該置換基で置換されていてもよい、直鎖の飽和 C_1-C_9 脂肪族基、直鎖の不飽和 C_1-C_9 脂肪族基、分枝鎖の飽和 C_1-C_9 脂肪族基、分枝鎖の不飽和の C_1-C_9 脂肪族基、 C_1-C_6 アルコキシ基、 C_1-C_6 アルキルチオ基及び $N-C_1-C_6$ アルキルアミノ基からなる群より選択される置換基からなる群より選択される置換基を 1 又はそれ以上有していてもよい、アリール基、アセナフチレン基、アダマンチル基、アンスリル基、インデニル基、ノルボルニル基及びフェナンスリル基からなる群より選択される 1 ないし 3 環性の C_7-C_{15} 炭素芳香環基又はイソオキサゾリル基、イソチアゾリル基、イミダゾリル基、オキサゾリル基、オキサジアゾリル基、チアゾリル基、チアジアゾリル基、チエニル基、トリアジニル基、トリアゾリル基、ピリジル基、ピラジニル基、ピリミジニル基、ピリダジニル基、ピラゾリル基、ピロリル基、ピラニル基、フリル基、15 フラザニル基、イミダゾリジニル基、イミダゾリニル基、テトラヒドロフラニル基、ピラゾリジニル基、ピラゾリニル基、ピペラジニル基、ピベリジニル基、ピロジニル基、ピロリニル基及びモルホリノ基からなる群より選択される 5 又は 6 員のヘテロ環基若しくはアクリジニル基、イソキノリル基、イソインドリル基、インダゾリル基、インドリル基、インドリジニル基、エチレンジオキシフェニル基、カルバゾリル基、キナゾリニル基、キノキサリニル基、キノリジニル基、キノリル基、クマロニル基、クロメニル基、フェナンスリジニル基、フェナンスロリニル基、ジベンゾフラニル基、ジベンゾチオフェニル基、シンノリニル基、チオナフテニル基、ナフチリジニル基、フェナジニル基、フェナキサジニル基、フェノチアジニル基、フタラジニル基、ブテリジニル基、ブリニル基、ベンゾイミダソリル基、ベンゾオキサゾリル基、ベンゾチアゾリル基、ベンゾトリアゾリル基、ベンゾフラニル基及びメチレンジオキシフェニル基からなる群より選ばれるヘテロ原子を 1 環系当たり 1 ないし 5 個有する 1 ないし 3 環性の複素芳香環基又は該アリール基、該炭素芳香環基、該ヘテロ環基若しくは該複素芳香環基で置換されていてもよい、直鎖

の飽和C₁—C₉脂肪族基、直鎖の不飽和C₁—C₉脂肪族基、分枝鎖の飽和C₁—C₉脂肪族基若しくは分枝鎖の不飽和のC₁—C₉脂肪族基を示すか、又はR³及びR⁴は、一緒になって、直鎖の飽和C₁—C₉脂肪族基、直鎖の不飽和C₁—C₉脂肪族基、分枝鎖の飽和C₁—C₉脂肪族基若しくは分枝鎖の不飽和のC₁—C₉脂肪族基又は5若しくは6員の飽和炭素環基若しくは5若しくは6員の不飽和の炭素環を形成し、X₁は、酸素原子、硫黄原子又は基：NR⁵（ここにおいて、R⁵は、水素原子、ハロゲン原子、ヒドロキシ基、N—C₁—C₆アルキルスルホニルアミノ基、C₁—C₆アルコキシ基、C₁—C₆アルコキシカルボニル基、C₂—C₆アルカノイル基、カルバモイル基及びN—C₁—C₁₀アルキルカルバモイル基からなる群から選択される置換基又は該置換基で置換されていてもよい、直鎖の飽和C₁—C₉脂肪族基、直鎖の不飽和C₁—C₉脂肪族基、分枝鎖の飽和C₁—C₉脂肪族基若しくは分枝鎖の不飽和のC₁—C₉脂肪族基を示す）、X₂は、酸素原子又は硫黄原子、Yは、酸素原子、硫黄原子又は基：NR⁵若しくは基：CR⁶R⁷（ここにおいて、R⁶は、水素原子、ハロゲン原子、ヒドロキシ基、N—C₁—C₆アルキルスルホニルアミノ基、C₁—C₆アルコキシ基、C₁—C₆アルコキシカルボニル基、C₂—C₆アルカノイル基、カルバモイル基及びN—C₁—C₁₀アルキルカルバモイル基からなる群から選択される置換基又は該置換基で置換されていてもよい、直鎖の飽和C₁—C₉脂肪族基、直鎖の不飽和C₁—C₉脂肪族基、分枝鎖の飽和C₁—C₉脂肪族基若しくは分枝鎖の不飽和のC₁—C₉脂肪族基、R⁷は、20 水素原子又はC₁—C₆アルキル基を示し、R⁵は、前記の意味を有する）、Zは、縮合アリール基、アセナフチレン基、アダマンチル基、アンスリル基、インダニル基、インデニル基、C₆—C₈シクロアルカニル基、C₆—C₈シクロアルカジエニル基、C₆—C₈シクロアルケニル基、ノルボルニル基、フェナンスリル基及びフレオレニル基からなる群より選択される2ないし3環性の飽和若しくは不飽和のC₆—C₁₅縮合炭素環基又はイソキノリル基、イソインドリル基、インダゾリル基、インドリル基、インドリジニル基、エチレンジオキシフェニル基、キナゾリニル基、キノキサリニル基、キノリジニル基、キノリル基、クマロニル基、クロメニル基、チオナフテニル基、ナフチリジニル基、ピリジル基、ピラジニル基、ピリミジニル基、ピリダジニル基、ピラニル基、フタラジル基、ベンゾイミ

ダゾリル基、ベンゾオキサゾリル基、ベンゾチアゾリル基、ベンゾトリアゾリル基、ベンゾフラニル基及びメチレンジオキシフェニル基からなる群より選択される6員のヘテロ環基若しくは窒素原子、酸素原子及び硫黄原子からなる群より選ばれるヘテロ原子を1環系当たり1ないし5個有する2ないし3環性の縮合複素

- 5 芳香環基を示す] で表される化合物又はその医薬上許容される塩。

(2) 一般式 [I-a]



- [式中、R^aは、アミノ基、カルバモイル基、カルバモイルアミノ基、カルバモイルオキシ基、カルボキシリ基、ニトロ基、ハロゲン原子、ヒドロキシ基、環状の飽和C₃–C₉脂肪族基、環状の不飽和C₃–C₉脂肪族基、アラルキル基、N–アラルキルアミノ基、アラルキルオキシ基、アラルキルカルボニル基、N–アラルキルカルバモイル基、アリール基、N–アリールアミノ基、アリールオキシ基、アリールスルホニル基、アリールスルホニルオキシ基、N–アリールスルホニルアミノ基、N–アリールスルホニルアミノC₁–C₁₀アルキルアミノ基、N–アリールスルホニルアミノC₁–C₁₀アルキルカルバモイル基、N–アリールスルホニルアミノC₁–C₆アルコキシカルボニル基、アリールスルファモイル基、アリールスルファモイルオキシ基、N–アリールスルファモイルC₁–C₁₀アルキルカルバモイル基、アリールスルファモイルC₁–C₆アルコキシカルボニル基、N–アリールカルバモイル基、アロイル基、アロキシ基、N–(N–アロイルアミノ)C₁–C₁₀アルキルカルバモイル基、N–アロイルアミノC₁–C₁₀アルコキシカルボニル基、C₂–C₆アルカノイル基、N–C₂–C₆アルカノイルアミノ基、N–C₁–C₆アルキルアミノ基、N, N–ジ–C₁–C₆アルキルアミノ基、N–C₁–C₁₀アルキルカルバモイル基、N–C₁–C₁₀アルキルチオカルバモイル基、N, N–ジ–C₁–C₁₀アルキルカルバモイル基、N, N–ジ–C₁–C₁

$\text{C}_1\text{-C}_6$ アルキルカルバモイル基、 $\text{N}-\text{C}_2-\text{C}_6$ アルケニルカルバモイル基、 $\text{N}-\text{C}_1-\text{C}_{10}$ アルキルカルバモイル基、 $\text{N}-\text{C}_1-\text{C}_6$ アルコキシカルボニル C_1-C_{10} アルキルカルバモイル基、 $\text{N}-\text{C}_1-\text{C}_6$ アルコキシカルボニルアミノ C_1-C_{10} アルキルカルバモイル基、 $\text{N}-\text{C}_1-\text{C}_6$ アルコキシカルボニルアミノ C_1-C_6 アルコキシカルボニル基、 C_1-C_6 アルキルチオ基、 C_1-C_6 アルキルスルフィニル基、 C_1-C_6 アルキルスルホニル基、 $\text{N}-\text{C}_1-\text{C}_6$ アルキルスルホニルアミノ基、 C_1-C_6 アルコキシ基、 C_1-C_6 アルコキシカルボニル基、アミノ C_1-C_6 アルコキシカルボニル基、 $\text{N}-\text{C}_3-\text{C}_6$ シクロアルキルアミノ基、 $\text{N}, \text{N}-\text{C}_3-\text{C}_6$ シクロアルキルアミノ基、 C_3-C_6 シクロアルキルオキシ基、 $\text{N}-\text{C}_3-\text{C}_6$ シクロアルキルカルバモイル基及び $\text{N}, \text{N}-\text{C}_3-\text{C}_6$ シクロアルキルカルバモイル基からなる群より選択される置換基、イソオキサゾリル基、イソチアゾリル基、イミダゾリル基、オキサゾリル基、オキサジアゾリル基、チアゾリル基、チアジアゾリル基、チエニル基、トリアゾリル基、ピリジル基、ピラジニル基、ピリミジニル基、ピリダジニル基、ピラゾリル基、ピロリル基、ピラニル基、フリル基、イミダゾリジニル基、イミダゾリニル基、テトラヒドロフラニル基、ピラゾリジニル基、ピラゾリニル基、ピペラジニル基、ピペリジニル基、ピロリジニル基、ピロリニル基及びモルホリノ基からなる群より選択される5又は6員のヘテロ環基、イソキノリル基、イソインドリル基、インダゾリル基、インドリル基、エチレンジオキシフェニル基、カルバゾリル基、キナゾリニル基、キノキサリニル基、キノリジニル基、キノリル基、クマロニル基、クロメニル基、フェナンスリジニル基、フェナンスロリニル基、ジベンゾフラニル基、ジベンゾチオフェニル基、シンノリニル基、チオナフテニル基、ナフチリジニル基、フェナジニル基、フェナキサジニル基、ベンゾイミダゾリル基、ベンゾオキサゾリル基、ベンゾチアゾリル基、ベンゾトリアゾリル基、ベンゾフラニル基及びメチレンジオキシフェニル基からなる群より選択される窒素原子、酸素原子及び硫黄原子からなる群より選ばれるヘテロ原子を1環系当たり1ないし5個有する1ないし3環性の複素芳香環基並びに該ヘテロ環基又は該複素芳香環基が置換した、 $\text{N}-\text{C}_1-\text{C}_{10}$ アルキルカルバモイル基、 $\text{N}-$

- $C_1 - C_{10}$ アルキルチオカルバモイル基、チオカルボニル基並びにカルボニル基からなる群から選択される置換基並びに該置換基で置換されていてもよい、直鎖の飽和 $C_1 - C_9$ 脂肪族基、直鎖の不飽和 $C_1 - C_9$ 脂肪族基、分枝鎖の飽和 $C_1 - C_9$ 脂肪族基、分枝鎖の不飽和の $C_1 - C_9$ 脂肪族基、 $C_1 - C_6$ アルコキシ基及び
- 5 $C_1 - C_6$ アルキルチオ基からなる群より選択される置換基からなる群より選択される置換基を1又はそれ以上有していてもよい、アリール基、アダマンチル基、アンスリル基、インデニル基、ノルボルニル基及びフェナ NSリル基からなる群より選択される1ないし3環性の $C_7 - C_{15}$ 炭素芳香環基又はイソオキサゾリル基、イソチアゾリル基、イミダゾリル基、オキサゾリル基、オキサジアゾリル基、
- 10 チアゾリル基、チアジアゾリル基、チエニル基、トリアゾリル基、ピリジル基、ピラジニル基、ピリミジニル基、ピリダジニル基、ピラゾリル基、ピロリル基、ピラニル基、フリル基、イミダゾリジニル基、イミダゾリニル基、テトラヒドロフラニル基、ピラゾリジニル基、ピラゾリニル基、ビペラジニル基、ビペリジニル基、ピロリジニル基、ピロリニル基及びモルホリノ基からなる群より選択される5又は6員のヘテロ環基若しくはイソキノリル基、イソインドリル基、インダゾリル基、インドリル基、エチレンジオキシフェニル基、カルバゾリル基、キナゾリニル基、キノキサリニル基、キノリジニル基、キノリル基、クマロニル基、クロメニル基、フェナンスリジニル基、フェナンスロリニル基、ジベンゾフラニル基、ジベンゾチオフェニル基、シンノリニル基、チオナフテニル基、ナフチリジニル基、フェナジニル基、フェナキサジニル基、ベンゾイミダゾリル基、ベンゾオキサゾリル基、ベンゾチアゾリル基、ベンゾトリアゾリル基、ベンゾフラニル基及びメチレンジオキシフェニル基からなる群より選択される窒素原子、酸素原子及び硫黄原子からなる群より選ばれるヘテロ原子を1環系当たり1ないし5個有する1ないし3環性の複素芳香環基、 R^{1a} 及び R^{2a} は、同一又は異なって、
- 15 水素原子、アミノ基、カルボキシル基、シアノ基、スルファモイル基、スルホ基、ニトロ基、ハロゲン原子、ヒドロキシ基、ホルミル基、環状の飽和 $C_3 - C_9$ 脂肪族基、環状の不飽和 $C_3 - C_9$ 脂肪族基、アラルキル基、アリール基、N-アリールアミノ基、アリールオキシ基、 $C_2 - C_6$ アルカノイル基、N-C₂-C₆アルカノイルアミノ基、アロイル基、N-C₁-C₆アルキルアミノ基、N、N-ジー-C

- $C_1 - C_6$ アルキルアミノ基、 $N - C_1 - C_{10}$ アルキルカルバモイル基、 $N - C_1 - C_6$ アルキルスルファモイル基、 $C_1 - C_6$ アルキルスルフィニル基、 $C_1 - C_6$ アルキルスルホニル基、 $N - C_1 - C_6$ アルキルスルホニルアミノ基、 $C_1 - C_6$ アルコキシ基、 $C_1 - C_6$ アルコキシカルボニル基、 $N - C_3 - C_6$ シクロアルキルアミノ基、 $C_3 - C_6$ シクロアルキルオキシ基及び $N - C_3 - C_6$ シクロアルキルカルバモイル基からなる群から選択される置換基又は該置換基で置換されていてもよい、直鎖の飽和 $C_1 - C_9$ 脂肪族基、直鎖の不飽和 $C_1 - C_9$ 脂肪族基、分枝鎖の飽和 $C_1 - C_9$ 脂肪族基、分枝鎖の不飽和の $C_1 - C_9$ 脂肪族基若しくは $C_1 - C_6$ アルコキシ基、 R^{3a} 及び R^{4a} は、同一又は異なって、水素原子、アジド基、アミジノ基、
 10 アミノ基、カルバモイル基、カルバモイルアミノ基、カルバモイルオキシ基、カルボキシル基、グアニジノ基、シアノ基、スルファモイル基、スルホ基、ニトロ基、ハロゲン原子、ヒドロキシ基、ホルミル基、ホルミルアミノ基、環状の飽和 $C_3 - C_9$ 脂肪族基、環状の不飽和 $C_3 - C_9$ 脂肪族基、 $C_2 - C_6$ アルカノイル基、 $N - C_1 - C_6$ アルキルアミノ基、 $N - C_1 - C_{10}$ アルキルカルバモイル基、 $C_1 - C_6$ アルキルチオ基、 $N - C_1 - C_6$ アルキルスルファモイル基、 $C_1 - C_6$ アルキルスルフィニル基、 $C_1 - C_6$ アルキルスルホニル基、 $N - C_1 - C_6$ アルキルスルホニルアミノ基、 $C_1 - C_6$ アルコキシ基、 $C_1 - C_6$ アルコキシカルボニル基及び $N - C_3 - C_6$ シクロアルキルアミノ基からなる群から選択される置換基、該置換基で置換されていてもよい、直鎖の飽和 $C_1 - C_9$ 脂肪族基、直鎖の不飽和 $C_1 - C_9$ 脂肪族基、分枝鎖の飽和 $C_1 - C_9$ 脂肪族基及び分枝鎖の不飽和の $C_1 - C_9$ 脂肪族基からなる群から選択される置換基アミノ基、カルバモイル基、カルバモイルアミノ基、カルバモイルオキシ基、カルボキシル基、ニトロ基、ハロゲン原子、ヒドロキシ基、環状の飽和 $C_3 - C_9$ 脂肪族基、環状の不飽和 $C_3 - C_9$ 脂肪族基、アラルキル基、 $N - \text{アラルキルアミノ基}$ 、アラルキルオキシ基、アラルキルカルボニル基、 $N - \text{アラルキルカルバモイル基}$ 、アリール基、 $N - \text{アリールアミノ基}$ 、アリールオキシ基、アリールスルホニル基、アリールスルホニルオキシ基、 $N - \text{アリールスルホニルアミノ基}$ 、 $N - \text{アリールスルホニルアミノ} C_1 - C_{10}$ アルキルアミノ基、 $N - \text{アリールスルホニルアミノ} C_1 - C_{10}$ アルキルカルバモイル基、 $N - \text{アリールスルホニルアミノ} C_1 - C_6$ アルコキシカルボニル基、アリールスル

ファモイル基、アリールスルファモイルオキシ基、N-アリールスルファモイル
C₁-C₁₀アルキルカルバモイル基、アリールスルファモイルC₁-C₆アルコキ
シカルボニル基、N-アリールカルバモイル基、アロイル基、アロキシ基、N-
(N-アロイルアミノ)C₁-C₁₀アルキルカルバモイル基、N-アロイルアミ
5 ノC₁-C₁₀アルコキシカルボニル基、C₂-C₆アルカノイル基、N-C₂-C₆
アルカノイルアミノ基、N-C₁-C₆アルキルアミノ基、N,N-ジ-C₁-C₆
アルキルアミノ基、N-C₁-C₁₀アルキルカルバモイル基、N-C₁-C₁₀アル
キルチオカルバモイル基、N,N-ジ-C₁-C₁₀アルキルカルバモイル基、N,
N-ジ-C₁-C₁₀アルキルチオカルバモイル基、N-C₂-C₆アルケニルカル
10 バモイル基、N,N-ジ-C₂-C₆アルケニルカルバモイル基、N-アミノC₁-
C₁₀アルキルカルバモイル基、N-C₁-C₆アルコキシC₁-C₁₀アルキルカル
バモイル基、N-C₁-C₆アルコキシカルボニルC₁-C₁₀アルキルカルバモイ
ル基、N-C₁-C₆アルコキシカルボニルアミノC₁-C₁₀アルキルカルバモイ
ル基、N-C₁-C₆アルコキシカルボニルアミノC₁-C₆アルコキシカルボニル
15 基、C₁-C₆アルキルチオ基、C₁-C₆アルキルスルフィニル基、C₁-C₆アル
キルスルホニル基、N-C₁-C₆アルキルスルホニルアミノ基、C₁-C₆アルコ
キシ基、C₁-C₆アルコキシカルボニル基、アミノC₁-C₆アルコキシカルボ
ニル基、N-C₃-C₆シクロアルキルアミノ基、N,N-ジ-C₃-C₆シクロアル
キルアミノ基、C₃-C₆シクロアルキルオキシ基、N-C₃-C₆シクロアル
20 キルカルバモイル基及びN,N-ジ-C₃-C₆シクロアルキルカルバモイル基か
らなる群より選択される置換基、イソオキサゾリル基、イソチアゾリル基、イミ
ダゾリル基、オキサゾリル基、オキサジアゾリル基、チアゾリル基、チアジアゾ
リル基、チエニル基、トリアゾリル基、ピリジル基、ピラジニル基、ピリミジニ
ル基、ピリダジニル基、ピラゾリル基、ピロリル基、ピラニル基、フリル基、イ
25 ミダゾリジニル基、イミダゾリニル基、テトラヒドロフラニル基、ピラゾリジニ
ル基、ピラゾリニル基、ピペラジニル基、ピペリジニル基、ピロリジニル基、ピ
ロリニル基及びモルホリノ基からなる群より選択される5又は6員のヘテロ環基、
イソキノリル基、イソインドリル基、インダゾリル基、インドリル基、エチレン
ジオキシフェニル基、カルバゾリル基、キナゾリニル基、キノキサリニル基、キ

ノリジニル基、キノリル基、クマロニル基、クロメニル基、フェナンスリジニル基、フェナンスロリニル基、ジベンゾフラニル基、ジベンゾチオフェニル基、シンノリニル基、チオナフテニル基、ナフチリジニル基、フェナジニル基、フェナキサジニル基、ベンゾイミダゾリル基、ベンゾオキサゾリル基、ベンゾチアゾリル基、ベンゾトリアゾリル基、ベンゾフラニル基及びメチレンジオキシフェニル基からなる群より選択される窒素原子、酸素原子及び硫黄原子からなる群より選ばれるヘテロ原子を1環系当たり1ないし5個有する1ないし3環性の複素芳香環基並びに該ヘテロ環基又は該複素芳香環基が置換した、N—C₁—C₁₀アルキルカルバモイル基、N—C₁—C₁₀アルキルチオカルバモイル基、チオカルボニル基並びにカルボニル基からなる群から選択される置換基並びに該置換基で置換されていてもよい、直鎖の飽和C₁—C₉脂肪族基、直鎖の不飽和C₁—C₉脂肪族基、分枝鎖の飽和C₁—C₉脂肪族基、分枝鎖の不飽和のC₁—C₉脂肪族基、C₁—C₆アルコキシ基及びC₁—C₆アルキルチオ基からなる群より選択される置換基からなる群より選択される置換基を1又はそれ以上有していてもよい、アリール基、アマンチル基、アンスリル基、インデニル基、ノルボルニル基及びフェナンスリル基からなる群より選択される1ないし3環性のC₇—C₁₅炭素芳香環基又はイソオキサゾリル基、イソチアゾリル基、イミダゾリル基、オキサゾリル基、オキサジアゾリル基、チアゾリル基、チアジアゾリル基、チエニル基、トリアゾリル基、ピリジル基、ピラジニル基、ピリミジニル基、ピリダジニル基、ピラゾリル基、ピロリル基、ピラニル基、フリル基、イミダゾリジニル基、イミダゾリニル基、テトラヒドロフラニル基、ピラゾリジニル基、ピラゾリニル基、ピペラジニル基、ピペリジニル基、ピロリジニル基、ピロリニル基及びモルホリノ基からなる群より選択される5又は6員のヘテロ環基若しくはイソキノリル基、イソインドリル基、インダゾリル基、インドリル基、エチレンジオキシフェニル基、カルバゾリル基、キナゾリニル基、キノキサリニル基、キノリジニル基、キノリル基、クマロニル基、クロメニル基、フェナンスリジニル基、フェナンスロリニル基、ジベンゾフラニル基、ジベンゾチオフェニル基、シンノリニル基、チオナフテニル基、ナフチリジニル基、フェナジニル基、フェナキサジニル基、ベンゾイミダゾリル基、ベンゾオキサゾリル基、ベンゾチアゾリル基、ベンゾトリアゾ

リル基、ベンゾフラニル基及びメチレンジオキシフェニル基からなる群より選択される窒素原子、酸素原子及び硫黄原子からなる群より選ばれるヘテロ原子を1環系当たり1ないし5個有する1ないし3環性の複素芳香環基又は該アリール基、該炭素芳香環基、該ヘテロ環基若しくは該複素芳香環基で置換されていてもよい、

5 直鎖の飽和C₁—C₉脂肪族基、直鎖の不飽和C₁—C₉脂肪族基、分枝鎖の飽和C₁—C₉脂肪族基若しくは分枝鎖の不飽和のC₁—C₉脂肪族基を示すか、又はR³^a及びR⁴^aは、一緒になって、直鎖の飽和C₁—C₉脂肪族基、直鎖の不飽和C₁—C₉脂肪族基、分枝鎖の飽和C₁—C₉脂肪族基若しくは分枝鎖の不飽和のC₁—C₉脂肪族基又は5若しくは6員の飽和炭素環基若しくは5若しくは6員の不飽和

10 の炭素環を形成し、X_{1a}は、酸素原子、硫黄原子又は基：N R^{5a}（ここにおいて、R^{5a}は、水素原子、ハロゲン原子、ヒドロキシ基、N—C₁—C₆アルキルスルホニルアミノ基、C₁—C₆アルコキシ基、C₁—C₆アルコキシカルボニル基、C₂—C₆アルカノイル基、カルバモイル基及びN—C₁—C₁₀アルキルカルバモイル基からなる群から選択される置換基又は該置換基で置換されていてもよい、直鎖の

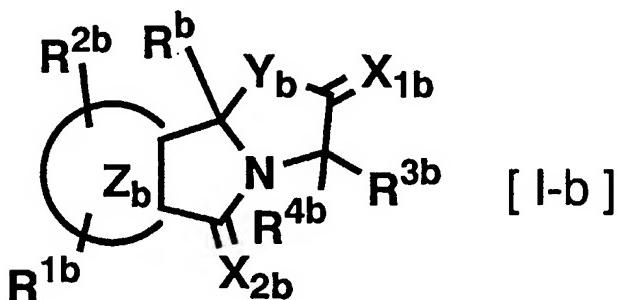
15 飽和C₁—C₉脂肪族基、直鎖の不飽和C₁—C₉脂肪族基、分枝鎖の飽和C₁—C₉脂肪族基若しくは分枝鎖の不飽和のC₁—C₉脂肪族基を示す）、X_{2a}は、酸素原子又は硫黄原子、Y_aは、酸素原子、硫黄原子又は基：N R^{5a}若しくは基：C R^{6a} R^{7a}（ここにおいて、R^{6a}は、水素原子、ハロゲン原子、ヒドロキシ基、N—C₁—C₆アルキルスルホニルアミノ基、C₁—C₆アルコキシ基、C₁—C₆アルコ

20 キシカルボニル基、C₂—C₆アルカノイル基、カルバモイル基及びN—C₁—C₁₀アルキルカルバモイル基からなる群から選択される置換基又は該置換基で置換されていてもよい、直鎖の飽和C₁—C₉脂肪族基、直鎖の不飽和C₁—C₉脂肪族基、分枝鎖の飽和C₁—C₉脂肪族基若しくは分枝鎖の不飽和のC₁—C₉脂肪族基、R^{7a}は、水素原子又はC₁—C₆アルキル基を示し、R^{5a}は、前記の意味を有する）、

25 Z_aは、縮合アリール基、アダマンチル基、アンスリル基、インダニル基、インデニル基、C₆—C₈シクロアルカニル基、C₆—C₈シクロアルカジエニル基、C₆—C₈シクロアルケニル基、ノルポルニル基及びフェナンスリル基からなる群より選択される2ないし3環性の飽和若しくは不飽和のC₆—C₁₅縮合炭素環基又はエチレンジオキシフェニル基、ピリジル基、ピラジニル基、ピリミジニル基、

- ピリダジニル基、ベンゾイミダゾリル基、ベンゾオキサゾリル基、ベンゾチアゾリル基、ベンゾトリアゾリル基、ベンゾフラニル基及びメチレンジオキシフェニル基からなる群より選択される6員のヘテロ環基若しくは窒素原子、酸素原子及び硫黄原子からなる群より選ばれるヘテロ原子を1環系当たり1ないし5個有する2ないし3環性の縮合複素芳香環基を示す]で表される請求項1記載の化合物又はその医薬上許容される塩。

(3) 一般式 [I-b]



- [式中、R^bは、アミノ基、カルバモイル基、カルボキシル基、ニトロ基、ハロゲン原子、ヒドロキシ基、アラルキルカルボニル基、N-アラルキルカルバモイル基、アリール基、アロイル基、C₂-C₆アルカノイル基、N-C₁-C₆アルキルアミノ基、N-C₁-C₁₀アルキルカルバモイル基、N-C₁-C₁₀アルキルチオカルバモイル基、N, N-ジ-C₁-C₁₀アルキルカルバモイル基、N, N-ジ-C₁-C₁₀アルキルチオカルバモイル基、N-C₂-C₆アルケニルカルバモイル基、N-C₁-C₁₀アルキルカルバモイル基、N-C₁-C₆アルコキカルボニル基、C₁-C₁₀アルキルカルバモイル基、C₁-C₆アルコキシカルボニル基、アミノC₁-C₆アルコキシカルボニル基、N-C₃-C₆シクロアルキルアミノ基、N, N-ジ-C₃-C₆シクロアルキルアミノ基、C₃-C₆シクロアルキルオキシ基、N-C₃-C₆シクロアルキルカルバモイル基及びN, N-ジ-C₃-C₆シクロアルキルカルバモイル基からなる群より選択される置換基、チエニル基、ピリジル基、ピラジニル基、ピリミジニル基、フリル基、テトラヒドロフラニル基及びモルホリノ基からなる群より選択される5又は6員のヘテロ環基、エチレンジオキシフェニル基、ジベンゾフラニル基、ジベンゾチ

オフェニル基及びメチレンジオキシフェニル基からなる群より選択される窒素原子、酸素原子及び硫黄原子からなる群より選ばれるヘテロ原子を1環系当たり1ないし5個有する1ないし3環性の複素芳香環基並びに該ヘテロ環基又は該複素芳香環基が置換した、 $N-C_1-C_{10}$ アルキルカルバモイル基、 $N-C_1-C_{10}$

5 アルキルチオカルバモイル基、チオカルボニル基並びにカルボニル基からなる群から選択される置換基並びに該置換基で置換されていてもよい、直鎖の飽和 C_1-C_9 脂肪族基、直鎖の不飽和 C_1-C_9 脂肪族基、分枝鎖の飽和 C_1-C_9 脂肪族基、分枝鎖の不飽和の C_1-C_9 脂肪族基及び C_1-C_6 アルコキシ基からなる群より選択される置換基からなる群より選択される置換基を1又はそれ以上有してい

10 てもよい、アリール基、アンスリル基及びフェナスリル基からなる群より選択される1ないし3環性の C_7-C_{15} 炭素芳香環基又はチエニル基、ピリジル基、ピラジニル基、ピリミジニル基、フリル基、テトラヒドロフラニル基及びモルホリノ基からなる群より選択される5又は6員のヘテロ環基若しくはエチレンジオキシフェニル基、ジベンゾフラニル基、ジベンゾチオフェニル基及びメチレンジオキシフェニル基からなる群より選択される窒素原子、酸素原子及び硫黄原子からなる群より選ばれるヘテロ原子を1環系当たり1ないし5個有する1ないし3環性の複素芳香環基、 R^{1b} 及び R^{2b} は、同一又は異なって、水素原子、アミノ基、ニトロ基、ハロゲン原子、ヒドロキシ基、アリール基、 N -アリールアミノ基、 $N-C_1-C_6$ アルキルアミノ基、 N , N -ジ- C_1-C_6 アルキルアミノ基、 $N-C_1-C_{10}$

15 アルキルカルバモイル基、 C_1-C_6 アルコキシ基、 C_1-C_6 アルコキシカルボニル基及び $N-C_3-C_6$ シクロアルキルアミノ基からなる群から選択される置換基又は該置換基で置換されていてもよい、直鎖の飽和 C_1-C_9 脂肪族基、直鎖の不飽和 C_1-C_9 脂肪族基、分枝鎖の飽和 C_1-C_9 脂肪族基、分枝鎖の不飽和の C_1-C_9 脂肪族基若しくは C_1-C_6 アルコキシ基、 R^{3b} 及び R^{4b} は、

20 同一又は異なって、水素原子、アジド基、アミジノ基、アミノ基、カルバモイル基、カルボキシル基、グアニジノ基、シアノ基、スルファモイル基、スルホ基、ニトロ基、ハロゲン原子、ヒドロキシ基、ホルミル基、環状の飽和 C_3-C_9 脂肪族基、環状の不飽和 C_3-C_9 脂肪族基、 $N-C_1-C_6$ アルキルアミノ基、 $N-C_1-C_{10}$ アルキルカルバモイル基、 C_1-C_6 アルキルチオ基、 C_1-C_6 アルコキ

シ基及び C_1-C_6 アルコキシカルボニル基からなる群から選択される置換基、該置換基で置換されていてもよい、直鎖の飽和 C_1-C_9 脂肪族基、直鎖の不飽和 C_1-C_9 脂肪族基、分枝鎖の飽和 C_1-C_9 脂肪族基及び分枝鎖の不飽和の C_1-C_9 脂肪族基からなる群から選択される置換基、アミノ基、カルバモイル基、カルボキシリル基、ニトロ基、ハロゲン原子、ヒドロキシ基、アラルキルカルボニル基、
 5 N-アラルキルカルバモイル基、アリール基、アロイル基、 C_2-C_6 アルカノイル基、N- C_1-C_6 アルキルアミノ基、N- C_1-C_{10} アルキルカルバモイル基、N- C_1-C_{10} アルキルチオカルバモイル基、N, N-ジ- C_1-C_{10} アルキルカルバモイル基、N, N-ジ- C_1-C_{10} アルキルチオカルバモイル基、N- C_2-C_6 アルケニルカルバモイル基、N, N-ジ- C_2-C_6 アルケニルカルバモイル基、N-アミノ C_1-C_{10} アルキルカルバモイル基、N- C_1-C_6 アルコキシ C_1-C_{10} アルキルカルバモイル基、N- C_1-C_6 アルコキシカルボニル C_1-C_1 アルキルカルバモイル基、 C_1-C_6 アルコキシ基、アミノ C_1-C_6 アルコキシカルボニル基、N- C_3-C_6 シクロアルキルアミノ基、N, N-ジ- C_3-C_6 シクロアルキルカルバモイル基からなる群より選択される置換基、チエニル基、ピリジル基、ピラジニル基、ピリミジニル基、フリル基、テトラヒドロフラニル基及びモルホリノ基からなる群より選択される5又は6員のヘテロ環基、エチレンジオキシフェニル基、
 20 ジベンゾフラニル基、ジベンゾチオフェニル基及びメチレンジオキシフェニル基からなる群より選択される窒素原子、酸素原子及び硫黄原子からなる群より選ばれるヘテロ原子を1環系当たり1ないし5個有する1ないし3環性の複素芳香環基並びに該ヘテロ環基又は該複素芳香環基が置換した、N- C_1-C_{10} アルキルカルバモイル基、N- C_1-C_{10} アルキルチオカルバモイル基、チオカルボニル基並びにカルボニル基からなる群から選択される置換基並びに該置換基で置換されていてもよい、直鎖の飽和 C_1-C_9 脂肪族基、直鎖の不飽和 C_1-C_9 脂肪族基、分枝鎖の飽和 C_1-C_9 脂肪族基、分枝鎖の不飽和の C_1-C_9 脂肪族基及び C_1-C_6 アルコキシ基からなる群より選択される置換基からなる群より選択される置換基を1又はそれ以上有していてもよい、アリール基、アンスリル基及びフェナ

ンスリル基からなる群より選択される 1 ないし 3 環性の $C_7 - C_{15}$ 炭素芳香環基又はチエニル基、ピリジル基、ピラジニル基、ピリミジニル基、フリル基、テトラヒドロフラニル基及びモルホリノ基からなる群より選択される 5 又は 6 員のヘテロ環基若しくはエチレンジオキシフェニル基、ジベンゾフラニル基、ジベンゾチオフェニル基及びメチレンジオキシフェニル基からなる群より選択される窒素原子、酸素原子及び硫黄原子からなる群より選ばれるヘテロ原子を 1 環系当たり 1 ないし 5 個有する 1 ないし 3 環性の複素芳香環基又は該アリール基、該炭素芳香環基、該ヘテロ環基若しくは該複素芳香環基で置換されていてもよい、直鎖の飽和 $C_1 - C_9$ 脂肪族基、直鎖の不飽和 $C_1 - C_9$ 脂肪族基、分枝鎖の飽和 $C_1 - C_9$

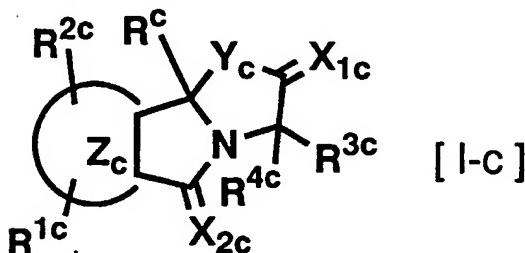
5 脂肪族基若しくは分枝鎖の不飽和の $C_1 - C_9$ 脂肪族基を示すか、又は R^{3b} 及び R^{4b} は、一緒になって、直鎖の不飽和 $C_1 - C_9$ 脂肪族基又は 5 若しくは 6 員の飽和炭素環基を形成し、 X_{1b} は、酸素原子又は基 : NR^{5b} (ここにおいて、 R^{5b} は、水素原子、ヒドロキシ基、 $C_1 - C_6$ アルコキシ基、 $C_1 - C_6$ アルコキシカルボニル基及び $N - C_1 - C_{10}$ アルキルカルバモイル基からなる群から選択される置換

10 15 基又は該置換基で置換されていてもよい、直鎖の飽和 $C_1 - C_9$ 脂肪族基、直鎖の不飽和 $C_1 - C_9$ 脂肪族基、分枝鎖の飽和 $C_1 - C_9$ 脂肪族基若しくは分枝鎖の不飽和の $C_1 - C_9$ 脂肪族基を示す)、 X_{2b} は、酸素原子又は硫黄原子、 Y_b は、酸素原子、硫黄原子又は基 : $CR^{6b}R^{7b}$ (ここにおいて、 R^{6b} は、水素原子、ヒドロキシ基、 $C_1 - C_6$ アルコキシ基、 $C_1 - C_6$ アルコキシカルボニル基及び $N - C_1 - C_{10}$ アルキルカルバモイル基からなる群から選択される置換基又は該置換基で置換されていてもよい、直鎖の飽和 $C_1 - C_9$ 脂肪族基、直鎖の不飽和 $C_1 - C_9$ 脂肪族基、分枝鎖の飽和 $C_1 - C_9$ 脂肪族基若しくは分枝鎖の不飽和の $C_1 - C_9$ 脂肪族基、 R^{7b} は、水素原子又は $C_1 - C_6$ アルキル基を示す)、 Z_b は、縮合アリール基、アンスリル基、 $C_6 - C_8$ シクロアルカニル基、 $C_6 - C_8$ シクロアルカジエニル基及び $C_6 - C_8$ シクロアルケニル基からなる群より選択される 2 ないし 3 環性の飽和若しくは不飽和の $C_6 - C_{15}$ 縮合炭素環基又はエチレンジオキシフェニル基、ピリジル基、ピラジニル基、ピリミジニル基、ピリダジニル基及びメチレンジオキシフェニル基からなる群より選択される 6 員のヘテロ環基若しくは窒素原子、酸素原子及び硫黄原子からなる群より選ばれるヘテロ原子を 1 環系

20 25

当たり1ないし5個有する2ないし3環性の縮合複素芳香環基を示す]で表される請求項1又は請求項2記載の化合物又はその医薬上許容される塩。

(4) 一般式 [I-c]

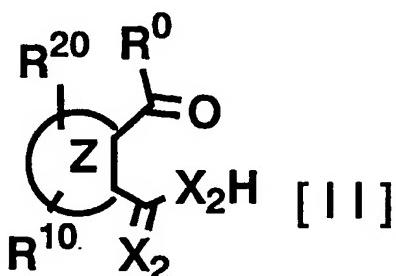


- 5 [式中、R^cは、置換基を有していてもよい、アリール基、1ないし3環性のC₇—C₁₅炭素芳香環基（但し、アリール基を除く。）又は5若しくは6員のヘテロ環基若しくは窒素原子、酸素原子及び硫黄原子からなる群より選ばれるヘテロ原子を1環系当たり1ないし5個有する1ないし3環性の複素芳香環基（但し、5又は6員のヘテロ環基を除く。）、R^{1c}及びR^{2c}は、同一又は異なって、水素原子、
- 10 アジド基、アミノ基、カルバモイル基、カルバモイルアミノ基、カルバモイルオキシ基、カルボキシル基、シアノ基、スルファモイル基、スルホ基、ニトロ基、ハロゲン原子、ヒドロキシ基、ホルミル基、ホルミルアミノ基、環状の飽和若しくは不飽和のC₃—C₉脂肪族基、アラルキル基、N—アラルキルアミノ基、アラルキルオキシ基、アラルキルカルボニル基、アリール基、N—アリールアミノ基、アリールオキシ基、アリールスルホニル基、N—アリールスルホニルアミノ基、N—アリールスルホニルアミノC₁—C₆アルキルアミノ基、N—アリールスルホニルアミノC₁—C₆アルコキシカルボニル基、アリールスルホニルアミノC₁—C₆アルカノイル基、N—C₂—C₆アルカノイルアミノ基、アロイル基、N—アロイルアミノ基、N—アロイルC₁—C₆アル
- 15 キルアミノ基、N—アロイルC₁—C₁₀アルキルカルバモイル基、N—C₁—C₆アルキルアミノ基、N，N—ジ—C₁—C₆アルキルアミノ基、N—C₁—C₁₀アルキルカルバモイル基、N，N—ジ—C₁—C₁₀アルキルカルバモイル基、N—C₁—C₆アルキルスルファモイル基、C₁—C₆アルキルスルフィニル基、C₁—C₆アルキルスルホニル基、C₁—C₆アルキルチオ基、C₁—C₆アルコキシ基、
- 20 C₁—C₆アルコキシカルボニル基、N—C₃—C₆シクロアルキルアミノ基、C₃—
- 25

C_6 シクロアルキルオキシ基及び $N-C_3-C_6$ シクロアルキルカルバモイル基からなる群から選択される置換基又は該置換基で置換されていてもよい、直鎖若しくは分枝鎖の飽和若しくは不飽和の C_1-C_9 脂肪族基、 $N-C_1-C_6$ アルキルアミノ基、 C_1-C_6 アルキルチオ基若しくは C_1-C_6 アルコキシ基、 R^{3c} 及び R^{4c} は、同一又は異なって、水素原子、アジド基、アミジノ基、アミノ基、カルバモイル基、カルバモイルアミノ基、カルバモイルオキシ基、カルボキシリル基、グアニジノ基、シアノ基、スルファモイル基、スルホ基、ニトロ基、ハロゲン原子、ヒドロキシ基、ホルミル基、ホルミルアミノ基、環状の飽和若しくは不飽和の C_3-C_9 脂肪族基、 C_2-C_6 アルカノイル基、 $N-C_2-C_6$ アルカノイルアミノ基、 $N-C_1-C_6$ アルキルアミノ基、 $N-N-C_1-C_6$ アルキルカルバモイル基、 $N-N-C_1-C_{10}$ アルキルカルバモイル基、 C_1-C_6 アルキルチオ基、 $N-C_1-C_6$ アルキルスルファモイル基、 C_1-C_6 アルキルスルフィニル基、 C_1-C_6 アルキルスルホニル基、 C_1-C_6 アルコキシ基、 C_1-C_6 アルコキシカルボニル基、 $N-C_3-C_6$ シクロアルキルアミノ基、 C_3-C_6 シクロアルキルオキシ基及び $N-C_3-C_6$ シクロアルキルカルバモイル基からなる群から選択される置換基、該置換基で置換されていてもよい、直鎖若しくは分枝鎖の飽和若しくは不飽和の C_1-C_9 脂肪族基、置換基を有していてもよい、アリール基、1ないし3環性の C_7-C_{15} 炭素芳香環基（但し、アリール基を除く。）、5若しくは6員のヘテロ環基若しくは窒素原子、酸素原子及び硫黄原子からなる群より選ばれるヘテロ原子を1環系当たり1ないし5個有する1ないし3環性の複素芳香環基（但し、5又は6員のヘテロ環基を除く。）又は該アリール基、該炭素芳香環基、該ヘテロ環基若しくは該複素芳香環基で置換されていてもよい、直鎖若しくは分枝鎖の飽和若しくは不飽和の C_1-C_9 脂肪族基を示すか、又は R^{3c} 及び R^{4c} は、一緒になって、直鎖若しくは分枝鎖の不飽和の C_1-C_9 脂肪族基又は5若しくは6員の飽和若しくは不飽和の炭素環を形成し、 X_{1c} 及び X_{2c} は、同一又は異なって、酸素原子又は硫黄原子、 Y_c は、酸素原子、硫黄原子又は基： CHR^{5c} 若しくは基： NR^{5c} （ここにおいて、 R^{5c} は水素原子、ハロゲン原子、ヒドロキシ基、 C_1-C_6 アルコキシ基、 C_2-C_6 アルカノイル基、カルバモイル基及び $N-C_1-C_{10}$ アルキルカルバモイル基か

らなる群から選択される置換基又は該置換基で置換されていてもよい、直鎖若しくは分枝鎖の飽和若しくは不飽和のC₁—C₉脂肪族基を示す）、Z_cは、縮合アリール基、2ないし3環性の飽和若しくは不飽和のC₆—C₁₅縮合炭素環基（但し、縮合アリール基を除く。）又は6員のヘテロ環基若しくは窒素原子、酸素原子及び硫黄原子からなる群より選ばれるヘテロ原子を1環系当たり1ないし5個有する2ないし3環性の縮合複素芳香環基（但し、6員のヘテロ環基を除く。）を示す】で表される請求項1に記載の化合物又はその医薬上許容される塩。

（5）一般式 [II]



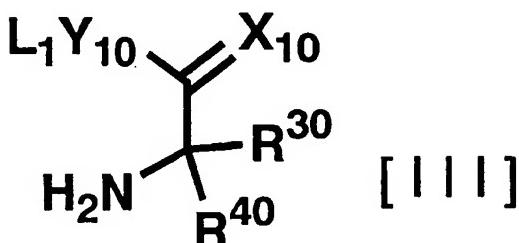
- 10 [式中、R⁰は、アジド基、保護されていてもよいアミノ基、カルバモイル基、カルバモイルアミノ基、カルバモイルオキシ基、保護されていてもよいカルボキシル基、シアノ基、スルファモイル基、スルホ基、ニトロ基、ハロゲン原子、保護されていてもよいヒドロキシ基、ホルミル基、ホルミルアミノ基、環状の飽和C₃—C₉脂肪族基、環状の不飽和C₃—C₉脂肪族基、アラルキル基、N—アラルキルアミノ基、N, N—ジアラルキルアミノ基、アラルキルオキシ基、アラルキルカルボニル基、N—アラルキルカルバモイル基、アリール基、N—アリールアミノ基、N, N—ジアリールアミノ基、アリールオキシ基、アリールスルホニル基、アリールスルホニルオキシ基、N—アリールスルホニルアミノ基、N—アリールスルホニルアミノC₁—C₁₀アルキルアミノ基、N—アリールスルホニルアミノC₁—C₆アルコキシカルボニル基、アリールスルファモイル基、アリールスルファモイルオキシ基、N—アリールスルファモイルC₁—C₁₀アルキルカルバモイル基、アリールスルファモイルC₁—C₆アルコキシカルボニル基、N—アリールカルバモイル基、アロイル基、アロキシ基、N—(N—アロイルアミノ)C₁—C₁₀アル
- 15
- 20

キルカルバモイル基、N-アロイルアミノC₁-C₁₀アルコキシカルボニル基、C₂-C₆アルカノイル基、N-C₂-C₆アルカノイルアミノ基、N, N-ジ-C₂-C₆アルカノイルアミノ基、N-C₁-C₆アルキルアミノ基、N, N-ジ-C₁-C₆アルキルアミノ基、N-C₁-C₁₀アルキルカルバモイル基、N-C₁-C₁₀アルキルチオカルバモイル基、N, N-ジ-C₁-C₁₀アルキルカルバモイル基、N-C₂-C₆アルケニルカルバモイル基、N, N-ジ-C₂-C₆アルケニルカルバモイル基、保護されていてもよいN-アミノC₁-C₁₀アルキルカルバモイル基、N-C₁-C₆アルコキシC₁-C₁₀アルキルカルバモイル基、N-C₁-C₆アルコキシカルボニルC₁-C₁₀アルキルカルバモイル基、N-C₁-C₆アルコキシカルボニルアミノC₁-C₁₀アルキルカルバモイル基、N-C₁-C₆アルコキシカルボニルアミノC₁-C₆アルコキシカルボニル基、C₁-C₆アルキルチオ基、N-C₁-C₆アルキルスルファモイル基、N, N-ジ-C₁-C₆アルキルスルファモイル基、C₁-C₆アルキルスルフィニル基、C₁-C₆アルキルスルホニル基、N-C₁-C₆アルキルスルホニルアミノ基、C₁-C₆アルコキシ基、C₁-C₆アルコキシカルボニル基、保護されていてもよいアミノC₁-C₆アルコキシカルボニル基、N-C₃-C₆シクロアルキルアミノ基、N, N-ジ-C₃-C₆シクロアルキルアミノ基、C₃-C₆シクロアルキルオキシ基、N-C₃-C₆シクロアルキルカルバモイル基及びN, N-ジ-C₃-C₆シクロアルキルカルバモイル基からなる群より選択される置換基、イソオキサゾリル基、イソチアゾリル基、イミダゾリル基、オキサゾリル基、オキサジアゾリル基、チアゾリル基、チアジアゾリル基、チエニル基、トリアジニル基、トリアゾリル基、ピリジル基、ピラジニル基、ピリミジニル基、ピリダジニル基、ピラゾリル基、ピロリル基、ピラニル基、フリル基、フラザニル基、イミダゾリジニル基、イミダゾリニル基、テトラヒドロフラニル基、ピラゾリジニル基、ピラゾリニル基、ピペラジニル基、ピベリジニル基、ピロリジニル基、ピロリニル基及びモルホリノ基からなる群より選択される5又は6員のヘテロ環基、アクリジニル基、イソキノリル基、イソインドリル基、インダゾリル基、インドリル基、インドリジニル基、エチレンジオキシフェニル基、カルバゾリル基、キナゾリニル基、キノキサリニル基、キノリジニル基、キノリ

ル基、クマロニル基、クロメニル基、フェナンスリジニル基、フェナンスロリニル基、ジベンゾフラニル基、ジベンゾチオフェニル基、シンノリニル基、チオナフテニル基、ナフチリジニル基、フェナジニル基、フェナキサジニル基、フェノチアジニル基、フタラジニル基、ブテリジニル基、ブリニル基、ベンゾイミダゾリル基、ベンゾオキサゾリル基、ベンゾチアゾリル基、ベンゾトリアゾリル基、ベンゾフラニル基及びメチレンジオキシフェニル基からなる群より選択される窒素原子、酸素原子及び硫黄原子からなる群より選ばれるヘテロ原子を1環系当たり1ないし5個有する1ないし3環性の複素芳香環基並びに該ヘテロ環基又は該複素芳香環基が置換した、N—C₁—C₁₀アルキルカルバモイル基、N—C₁—C₁₀アルキルチオカルバモイル基、チオカルボニル基並びにカルボニル基からなる群から選択される置換基並びに該置換基で置換されていてもよい、直鎖の飽和C₁—C₉脂肪族基、直鎖の不飽和C₁—C₉脂肪族基、分枝鎖の飽和C₁—C₉脂肪族基、分枝鎖の不飽和のC₁—C₉脂肪族基、C₁—C₆アルコキシ基、C₁—C₆アルキルチオ基及びN—C₁—C₆アルキルアミノ基からなる群より選択される置換基からなる群より選択される置換基を1又はそれ以上有していてもよい、アリール基、アセナフチレニル基、アダマンチル基、アンスリル基、インデニル基、ノルボルニル基及びフェナンスリル基からなる群より選択される1ないし3環性のC₇—C₁₅炭素芳香環基又はイソオキサゾリル基、イソチアゾリル基、イミダゾリル基、オキサゾリル基、オキサジアゾリル基、チアゾリル基、チアジアゾリル基、チエニル基、トリアジニル基、トリアゾリル基、ピリジル基、ピラジニル基、ピリミジニル基、ピリダジニル基、ピラゾリル基、ピロリル基、ピラニル基、フリル基、フラザニル基、イミダゾリジニル基、イミダゾリニル基、テトラヒドロフラニル基、ピラゾリジニル基、ピラゾリニル基、ピペラジニル基、ピペリジニル基、ピロリジニル基、ピロリニル基及びモルホリノ基からなる群より選択される5又は6員のヘテロ環基若しくはアクリジニル基、イソキノリル基、イソインドリル基、インダゾリル基、インドリル基、インドリジニル基、エチレンジオキシフェニル基、カルバゾリル基、キナゾリニル基、キノキサリニル基、キノリジニル基、キノリル基、クマロニル基、クロメニル基、フェナンスリジニル基、フェナンスロリニル基、ジベンゾフラニル基、ジベンゾチオフェニル基、シンノリニ

- ル基、チオナフテニル基、ナフチリジニル基、フェナジニル基、フェナキサジニル基、フェノチアジニル基、フタラジニル基、ブテリジニル基、ブリニル基、ベンゾイミダゾリル基、ベンゾオキサゾリル基、ベンゾチアゾリル基、ベンゾトリアゾリル基、ベンゾフラニル基及びメチレンジオキシフェニル基からなる群より
- 5 選択される窒素原子、酸素原子及び硫黄原子からなる群より選ばれるヘテロ原子を1環系当たり1ないし5個有する1ないし3環性の複素芳香環基、R¹⁰及びR²⁰は、同一又は異なって、水素原子、アジド基、保護されていてもよいアミノ基、カルバモイル基、カルバモイルアミノ基、カルバモイルオキシ基、保護されていてもよいカルボキシル基、シアノ基、スルファモイル基、スルホ基、ニトロ基、
- 10 ハロゲン原子、保護されていてもよいヒドロキシ基、ホルミル基、ホルミルアミノ基、環状の飽和C₃—C₉脂肪族基、環状の不飽和C₃—C₉脂肪族基、アラルキル基、N—アラルキルアミノ基、アラルキルオキシ基、アラルキルカルボニル基、アリール基、N—アリールアミノ基、アリールオキシ基、アリールスルホニル基、N—アリールスルホニルアミノ基、N—アリールスルホニルアミノC₁—C₁₀ア
- 15 ルキルアミノ基、N—アリールスルホニルアミノC₁—C₁₀アルキルカルバモイル基、N—アリールスルホニルアミノC₁—C₆アルコキシカルボニル基、C₂—C₆アルカノイル基、N—C₂—C₆アルカノイルアミノ基、アロイル基、N—アロイルアミノ基、N—アロイルC₁—C₁₀アルキルアミノ基、N—アロイルC₁—C₁₀アルキルカルバモイル基、N—C₁—C₆アルキルアミノ基、N、N—ジ—C₁—C₆アルキルアミノ基、N—C₁—C₁₀アルキルカルバモイル基、N、N—ジ—C₁—C₁₀アルキルカルバモイル基、N—C₁—C₆アルキルスルファモイル基、C₁—C₆アルキルスルフィニル基、C₁—C₆アルキルスルホニル基、N—C₁—C₆アルキルスルホニルアミノ基、C₁—C₆アルキルチオ基、C₁—C₆アルコキシ基、C₁—C₆アルコキシカルボニル基、N—C₃—C₆シクロアルキルアミノ基、
- 20 C₃—C₆シクロアルキルオキシ基及びN—C₃—C₆シクロアルキルカルバモイル基からなる群から選択される置換基又は該置換基で置換されていてもよい、直鎖の飽和C₁—C₉脂肪族基、直鎖の不飽和C₁—C₉脂肪族基、分枝鎖の飽和C₁—C₉脂肪族基、分枝鎖の不饱和のC₁—C₉脂肪族基、N—C₁—C₆アルキルアミノ基、C₁—C₆アルキルチオ基若しくはC₁—C₆アルコキシ基を示し、X₂及び

Zは、前記の意味を有する]で表されるカルボン酸又はチオカルボン酸と一般式
[III]



- [式中、Y₁₀は、酸素原子又は基：NR⁵⁰若しくは基：CR⁶⁰R⁷（ここにおいて、R⁵⁰は、水素原子、アミノ基の保護基、ハロゲン原子、保護されていてもよいヒドロキシ基、N—C₁—C₆アルキルスルホニルアミノ基、C₁—C₆アルコキシ基、C₁—C₆アルコキシカルボニル基、C₂—C₆アルカノイル基、カルバモイル基及びN—C₁—C₁₀アルキルカルバモイル基からなる群から選択される置換基又は該置換基で置換されていてもよい、直鎖の飽和C₁—C₉脂肪族基、直鎖の不飽和C₁—C₉脂肪族基、分枝鎖の飽和C₁—C₉脂肪族基若しくは分枝鎖の不飽和のC₁—C₉脂肪族基、R⁶⁰は、水素原子、ハロゲン原子、保護されていてもよいヒドロキシ基、N—C₁—C₆アルキルスルホニルアミノ基、C₁—C₆アルコキシ基、C₁—C₆アルコキシカルボニル基、C₂—C₆アルカノイル基、カルバモイル基及びN—C₁—C₁₀アルキルカルバモイル基からなる群から選択される置換基又は該置換基で置換されていてもよい、直鎖の飽和C₁—C₉脂肪族基、直鎖の不飽和C₁—C₉脂肪族基、分枝鎖の飽和C₁—C₉脂肪族基若しくは分枝鎖の不飽和のC₁—C₉脂肪族基を示し、R⁷は、前記の意味を有する）、R³⁰及びR⁴⁰は、同一又は異なって、水素原子、アジド基、アミジノ基、保護されていてもよいアミノ基、カルバモイル基、カルバモイルアミノ基、カルバモイルオキシ基、保護されていてもよいカルボキシリル基、グアニジノ基、シアノ基、スルファモイル基、スルホ基、ニトロ基、ハロゲン原子、保護されていてもよいヒドロキシ基、ホルミル基、ホルミルアミノ基、環状の飽和C₃—C₉脂肪族基、環状の不飽和C₃—C₉脂肪族基、C₂—C₆アルカノイル基、N—C₂—C₆アルカノイルアミノ基、N—C₁—C₆アルキルアミノ基、N, N—ジーC₁—C₆アルキルアミノ基、N—C₁—C₁₀アルキルカルバモイル基、N, N—ジーC₁—C₁₀アルキルカルバモイ

ル基、C₁—C₆アルキルチオ基、N—C₁—C₆アルキルスルファモイル基、C₁—C₆アルキルスルフィニル基、C₁—C₆アルキルスルホニル基、N—C₁—C₆アルキルスルホニルアミノ基、C₁—C₆アルコキシ基、C₁—C₆アルコキシカルボニル基、N—C₃—C₆シクロアルキルアミノ基、C₃—C₆シクロアルキルオキシ

- 5 基及び $N-C_3-C_6$ シクロアルキルカルバモイル基からなる群から選択される置換基、該置換基で置換されていてもよい、直鎖の飽和 C_1-C_9 脂肪族基、直鎖の不飽和 C_1-C_9 脂肪族基、分枝鎖の飽和 C_1-C_9 脂肪族基及び分枝鎖の不飽和の C_1-C_9 脂肪族基からなる群から選択される置換基、アジド基、保護されていてもよいアミノ基、カルバモイル基、カルバモイルアミノ基、カルバモイルオキシ基、保護されていてもよいカルボキシル基、シアノ基、スルファモイル基、スルホ基、ニトロ基、ハロゲン原子、保護されていてもよいヒドロキシ基、ホルミル基、ホルミルアミノ基、環状の飽和 C_3-C_9 脂肪族基、環状の不飽和 C_3-C_9 脂肪族基、アラルキル基、 N -アラルキルアミノ基、 N,N -ジアラルキルアミノ基、アラルキルオキシ基、アラルキルカルボニル基、 N -アラルキルカルバモイル基、アリール基、 N -アリールアミノ基、 N,N -ジアリールアミノ基、アリールオキシ基、アリールスルホニル基、アリールスルホニルオキシ基、 N -アリールスルホニルアミノ基、 N -アリールスルホニルアミノ C_1-C_{10} アルキルアミノ基、 N -アリールスルホニルアミノ C_1-C_{10} アルキルカルバモイル基、 N -アリールスルホニルアミノ C_1-C_6 アルコキシカルボニル基、アリールスルファモイル基、アリールスルファモイルオキシ基、 N -アリールスルファモイル基、アリールスルファモイル C_1-C_{10} アルキルカルバモイル基、アリールスルファモイル C_1-C_6 アルコキシカルボニル基、 N -アリールカルバモイル基、アロイル基、アロキシ基、 $N-(N$ -アロイルアミノ) C_1-C_{10} アルキルカルバモイル基、 N -アロイルアミノ C_1-C_{10} アルコキシカルボニル基、 C_2-C_6 アルカノイル基、 $N-C_2-C_6$ アルカノイルアミノ基、 N,N -ジ- C_2-C_6 アルカノイルアミノ基、 $N-C_1-C_6$ アルキルアミノ基、 N 、 N -ジ- C_1-C_6 アルキルアミノ基、 $N-C_1-C_{10}$ アルキルカルバモイル基、 $N-C_1-C_{10}$ アルキルチオカルバモイル基、 N,N -ジ- C_1-C_{10} アルキルカルバモイル基、 N 、 N -ジ- C_1-C_{10} アルキルチオカルバモイル基、 $N-C_2-C_6$ アルケニルカルバモイル基、 N 、 N -ジ- C_2-C_6

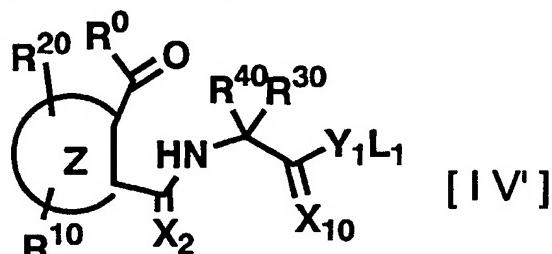
アルケニルカルバモイル基、保護されていてもよいN-アミノC₁-C₁₀アルキ
ルカルバモイル基、N-C₁-C₆アルコキシC₁-C₁₀アルキルカルバモイル基、
N-C₁-C₆アルコキシカルボニルC₁-C₁₀アルキルカルバモイル基、N-C
1-C₆アルコキシカルボニルアミノC₁-C₁₀アルキルカルバモイル基、N-C
5 1-C₆アルコキシカルボニルアミノC₁-C₆アルコキシカルボニル基、C₁-C₆
アルキルチオ基、N-C₁-C₆アルキルスルファモイル基、N, N-ジ-C₁-
C₆アルキルスルファモイル基、C₁-C₆アルキルスルフィニル基、C₁-C₆ア
ルキルスルホニル基、N-C₁-C₆アルキルスルホニルアミノ基、C₁-C₆アル
コキシ基、C₁-C₆アルコキシカルボニル基、保護されていてもよい アミノC
10 1-C₆アルコキシカルボニル基、N-C₃-C₆シクロアルキルアミノ基、N, N-
ジ-C₃-C₆シクロアルキルアミノ基、C₃-C₆シクロアルキルオキシ基、N-
C₃-C₆シクロアルキルカルバモイル基及びN, N-ジ-C₃-C₆シクロアルキ
ルカルバモイル基からなる群より選択される置換基、イソオキサゾリル基、イソ
15 チアゾリル基、イミダゾリル基、オキサゾリル基、オキサジアゾリル基、チアゾ
リル基、チアジアゾリル基、チエニル基、トリアジニル基、トリアゾリル基、ピ
リジル基、ピラジニル基、ピリミジニル基、ピリダジニル基、ピラゾリル基、ピ
ロリル基、ピラニル基、フリル基、フラザニル基、イミダゾリジニル基、イミダ
ゾリニル基、テトラヒドロフラニル基、ピラゾリジニル基、ピラゾリニル基、ピ
ペラジニル基、ピペリジニル基、ピロリジニル基、ピロリニル基及びモルホリノ
20 基からなる群より選択される5又は6員のヘテロ環基、アクリジニル基、イソキ
ノリル基、イソインドリル基、インダゾリル基、インドリル基、インドリジニル
基、エチレンジオキシフェニル基、カルバゾリル基、キナゾリニル基、キノキサ
リニル基、キノリジニル基、キノリル基、クマロニル基、クロメニル基、フェナ
ンスリジニル基、フェナンスロリニル基、ジベンゾフラニル基、ジベンゾチオフェ
25 ニル基、シンノリニル基、チオナフテニル基、ナフチリジニル基、フェナジニル
基、フェナキサジニル基、フェノチアジニル基、フタラジニル基、ブテリジニル
基、ブリニル基、ベンゾイミダゾリル基、ベンゾオキサゾリル基、ベンゾチアゾ
リル基、ベンゾトリアゾリル基、ベンゾフラニル基及びメチレンジオキシフェニ
ル基からなる群より選択される窒素原子、酸素原子及び硫黄原子からなる群より

- 選ばれるヘテロ原子を 1 環系当たり 1 ないし 5 個有する 1 ないし 3 環性の複素芳香環基並びに該ヘテロ環基又は該複素芳香環基が置換した、 $N-C_1-C_{10}$ アルキルカルバモイル基、 $N-C_1-C_{10}$ アルキルチオカルバモイル基、チオカルボニル基並びにカルボニル基からなる群から選択される置換基並びに該置換基で置換されていてもよい、直鎖の飽和 C_1-C_9 脂肪族基、直鎖の不飽和 C_1-C_9 脂肪族基、分枝鎖の飽和 C_1-C_9 脂肪族基、分枝鎖の不飽和の C_1-C_9 脂肪族基、 C_1-C_6 アルコキシ基、 C_1-C_6 アルキルチオ基及び $N-C_1-C_6$ アルキルアミノ基からなる群より選択される置換基からなる群より選択される置換基を 1 又はそれ以上有していてもよい、アリール基、アセナフチレン基、アダマンチル基、
- 10 アンスリル基、インデニル基、ノルボルニル基及びフェナンスリル基からなる群より選択される 1 ないし 3 環性の C_7-C_{15} 炭素芳香環基又はイソオキサゾリル基、イソチアゾリル基、イミダゾリル基、オキサゾリル基、オキサジアゾリル基、チアゾリル基、チアジアゾリル基、チエニル基、トリアジニル基、トリアゾリル基、ピリジル基、ピラジニル基、ピリミジニル基、ピリダジニル基、ピラゾリル基、ピロリル基、ピラニル基、フリル基、フラザニル基、イミダゾリジニル基、イミダゾリニル基、テトラヒドロフラニル基、ピラゾリジニル基、ピラゾリニル基、ピペラジニル基、ピペリジニル基、ピロリジニル基、ピロリニル基及びモルホリノ基からなる群より選択される 5 又は 6 員のヘテロ環基若しくはアクリジニル基、イソキノリル基、イソインドリル基、インダゾリル基、インドリル基、インドリジニル基、エチレンジオキシフェニル基、カルバゾリル基、キナゾリニル基、キノキサリニル基、キノリジニル基、キノリル基、クマロニル基、クロメニル基、フェナンスリジニル基、フェナンスロリニル基、ジベンゾフラニル基、ジベンゾチオフェニル基、シンノリニル基、チオナフテニル基、ナフチリジニル基、フェナジニル基、フェナキサジニル基、フェノチアジニル基、フタラジニル基、
- 20 プテリジニル基、プリニル基、ベンゾイミダゾリル基、ベンゾオキサゾリル基、ベンゾチアゾリル基、ベンゾトリアゾリル基、ベンゾフラニル基及びメチレンジオキシフェニル基からなる群より選択される窒素原子、酸素原子及び硫黄原子からなる群より選ばれるヘテロ原子を 1 環系当たり 1 ないし 5 個有する 1 ないし 3 環性の複素芳香環基又は該アリール基、該炭素芳香環基、該ヘテロ環基若しくは

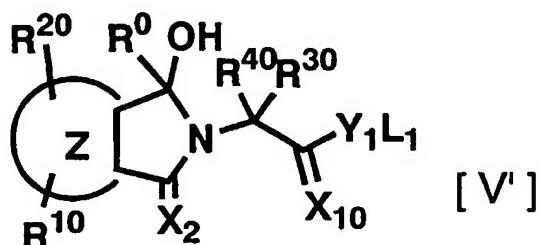
該複素芳香環基で置換されていてもよい、直鎖の飽和C₁—C₉脂肪族基、直鎖の不飽和C₁—C₉脂肪族基、分枝鎖の飽和C₁—C₉脂肪族基若しくは分枝鎖の不飽和のC₁—C₉脂肪族基を示すか、又はR³⁰及びR⁴⁰は、一緒になって、直鎖の飽和C₁—C₉脂肪族基、直鎖の不飽和C₁—C₉脂肪族基、分枝鎖の飽和C₁—C₉

5 脂肪族基若しくは分枝鎖の不飽和のC₁—C₉脂肪族基又は5若しくは6員の飽和炭素環基若しくは5若しくは6員の不飽和の炭素環を形成し、L₁は、水素原子、カルボキシル基の保護基若しくはアミノ基の保護基又はペプチドの固相合成におけるカルボキシル基若しくはアミノ基の樹脂担体、X₁₀は、酸素原子、硫黄原子又は基：NR⁵⁰（ここにおいて、R⁵⁰は前記の意味を有する）を示す]で表

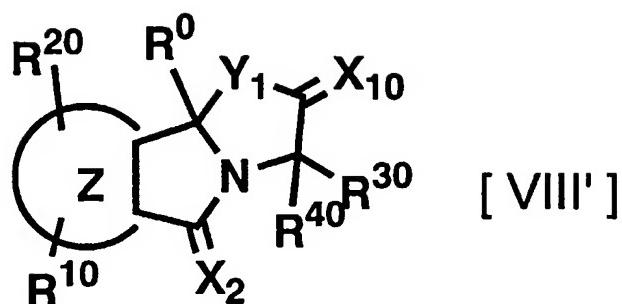
10 されるアミン誘導体とを反応させ、アミノ基の保護基、ヒドロキシ基の保護基又はカルボキシル基の保護基を適宜除去することにより、一般式[V']



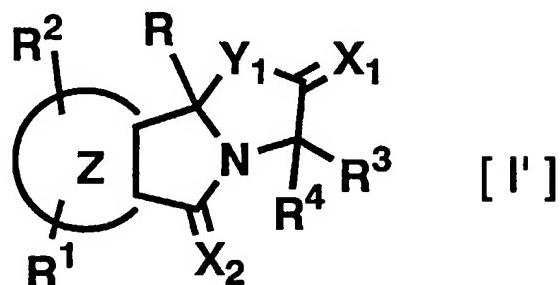
[式中、Y₁は、酸素原子又は基：NR⁵若しくは基：CR⁶R⁷（ここにおいて、R⁵、R⁶及びR⁷は、前記の意味を有する）を示し、R⁰、R¹⁰、R²⁰、R³⁰、15 R⁴⁰、L₁、X₂、X₁₀及びZは前記の意味を有する]で表される化合物及び一般式[V']



[式中、R⁰、R¹⁰、R²⁰、R³⁰、R⁴⁰、L₁、X₂、X₁₀、Y₁及びZは、前記の意味を有する]で表される化合物の平衡混合物とし、次いで当該平衡混合物を、20 不活性有機溶媒中で、酸と反応させて、一般式[V III']

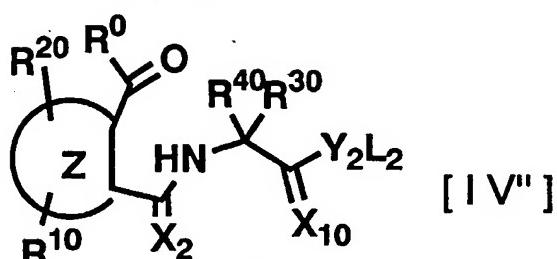


[式中、R⁰、R¹⁰、R²⁰、R³⁰、R⁴⁰、X₂、X₁₀、Y₁及びZは、前記の意味を有する]で表される化合物とし、適宜保護基を除去することを特徴とする、一般式[I']

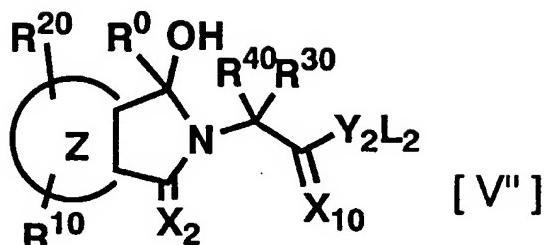


5 [式中、R、R¹、R²、R³、R⁴、X₁、X₂、Y₁及びZは、前記の意味を有する]で表される化合物又はその医薬上許容される塩の製造法。

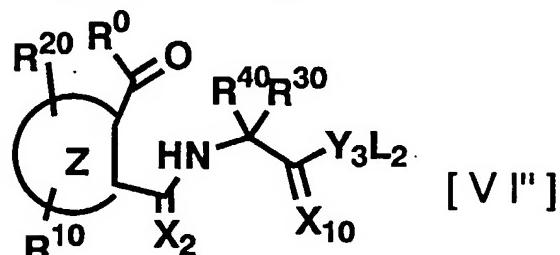
(6) 一般式[IV'']



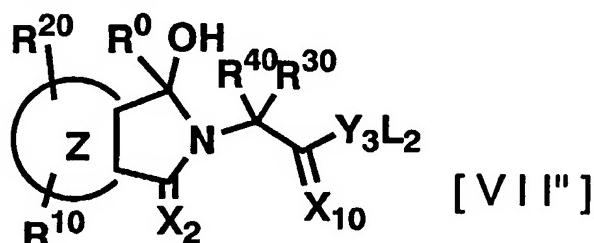
10 [式中、Y₂は、酸素原子、L₂は、水素原子を示し、R⁰、R¹⁰、R²⁰、R³⁰、R⁴⁰、X₂、X₁₀及びZは、前記の意味を有する]で表される化合物と一般式[V'']



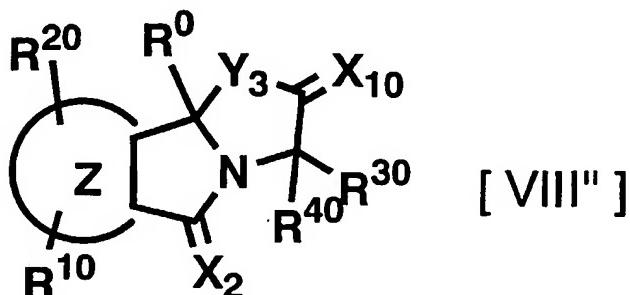
[式中、R⁰、R¹⁰、R²⁰、R³⁰、R⁴⁰、L₂、X₂、X₁₀、Y₂及びZは、前記の意味を有する]で表される化合物との平衡混合物とし、該平衡混合物と硫化剤とを反応させ、一般式[V I'']



5 [式中、Y₃は硫黄原子を示し、R⁰、R¹⁰、R²⁰、R³⁰、R⁴⁰、L₂、X₂、X₁₀及びZは、前記の意味を有する]で表される化合物と一般式[V I I'']

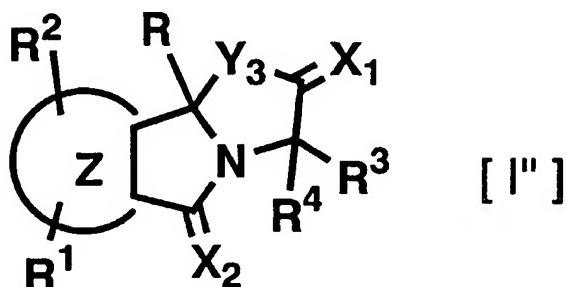


10 [式中、R⁰、R¹⁰、R²⁰、R³⁰、R⁴⁰、L₂、X₂、X₁₀、Y₃及びZは、前記の意味を有する]で表される化合物との平衡混合物とし、次いで、酸と反応させて、一般式[V I I I'']



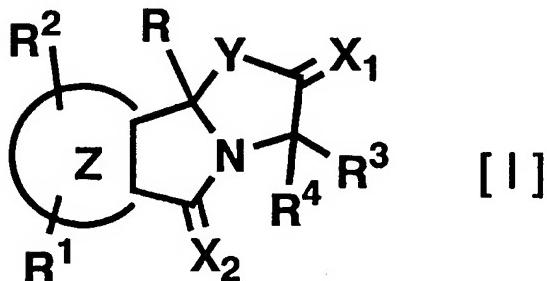
[式中、 R^0 、 R^{10} 、 R^{20} 、 R^{30} 、 R^{40} 、 X_2 、 X_{10} 、 Y_3 及び Z は、前記の意味を有する]で表される化合物とし、適宜保護基を除去することを特徴とする。

一般式 [I'']



- 5 [式中、 R 、 R^1 、 R^2 、 R^3 、 R^4 、 X_1 、 X_2 、 Y_3 及び Z は、前記の意味を有する]で表される化合物又はその医薬上許容される塩の製造法。

(7) 一般式 [I]



[式中、 R 、 R^1 、 R^2 、 R^3 、 R^4 、 X_1 、 X_2 、 Y 及び Z は前記の意味を有する。]

- 10 で表される化合物又はその医薬上許容される塩を有効成分として含有する糖尿病治療剤、糖尿病の慢性合併症の予防剤又は抗肥満剤。

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International application No.

PCT/JP00/05723

A. CLASSIFICATION OF SUBJECT MATTER

Int.C1⁷ C07D491/048, 491/147, 487/04, 471/14, 487/14, 513/04, 513/14, 498/14, 498/04, A61K31/424, 31/437, 31/4188, 31/4985, 31/407, 31/519, 31/5377, 31/4439, 31/429, 31/5025, A61P3/10, 3/04

According to International Patent Classification (IPC) or to both national classification and IPC

B. FIELDS SEARCHED

Minimum documentation searched (classification system followed by classification symbols)

Int.C1⁷ C07D491/048, 491/147, 487/04, 471/14, 487/14, 513/04, 513/14, 498/14, 498/04, A61K31/424, 31/437, 31/4188, 31/4985, 31/407, 31/519, 31/5377, 31/4439, 31/429, 31/5025, A61P3/10, 3/04

Documentation searched other than minimum documentation to the extent that such documents are included in the fields searched

Electronic data base consulted during the international search (name of data base and, where practicable, search terms used)
CAPLUS (STN), CAOLD (STN), REGISTRY (STN)

C. DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT

| Category* | Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages | Relevant to claim No. |
|-----------|--|-----------------------|
| X A | US, 4701208, A (American Cyanamid Co.), 20 October, 1987 (20.10.87), Examples 51 to 52A & EP, 133309, A1 & EP, 277661, A1 & ES, 534790, A1 & JP, 60-069083, A & JP, 6-116264, A | 1-5 6,7 |
| X A | EP, 195745, A1 (CIBA-GEIGY A.G.), 24 September, 1986 (24.09.86), Tables 1-9 & JP, 61-212586, A & US, 4721522, A & US, 4726838, A & US, 4743296, A | 1-5 6,7 |
| X A | JP, 63-295575, A (Nissan Chemical Industries, Ltd.), 01 December, 1988 (01.12.88), Table 1 (Family: none) | 1-5 6,7 |
| X A | Tecle, Berhane, et al., 'Differential routes of metabolism of imidazolinones: basis for soybean (Glycine max) selectivity' Pestic. Biochem. Physiol. (1993), Vol.46, No.2, pp.120-30, Fig.6 | 1-5 6,7 |

Further documents are listed in the continuation of Box C. See patent family annex.

| | |
|---|--|
| "A" Special categories of cited documents: "A" document defining the general state of the art which is not considered to be of particular relevance "E" earlier document but published on or after the international filing date "L" document which may throw doubts on priority claim(s) or which is cited to establish the publication date of another citation or other special reason (as specified) "O" document referring to an oral disclosure, use, exhibition or other means "P" document published prior to the international filing date but later than the priority date claimed | "T" later document published after the international filing date or priority date and not in conflict with the application but cited to understand the principle or theory underlying the invention "X" document of particular relevance; the claimed invention cannot be considered novel or cannot be considered to involve an inventive step when the document is taken alone "Y" document of particular relevance; the claimed invention cannot be considered to involve an inventive step when the document is combined with one or more other such documents, such combination being obvious to a person skilled in the art "&" document member of the same patent family |
|---|--|

| | |
|---|--|
| Date of the actual completion of the international search 28 November, 2000 (28.11.00) | Date of mailing of the international search report 12 December, 2000 (12.12.00) |
|---|--|

| | |
|--|--------------------|
| Name and mailing address of the ISA/ Japanese Patent Office | Authorized officer |
| Facsimile No. | Telephone No. |

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International application No.

PCT/JP00/05723

| C (Continuation). DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT | | |
|---|--|-----------------------|
| Category* | Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages | Relevant to claim No. |
| X A | US, 4846876, A (Bayer A.G.), 11 July, 1989 (11.07.89), Table 1 & DE, 3634952, A1 & EP, 267412, A1 & JP, 63-112582, A | 1-4 5-7 |
| X A | US, 4997947, A (Ciba-Geigy A.G.), 05 March, 1991 (05.03.91), Tables 3.00-3.16 and 12.00-12.02 & EP, 296109, A2 & JP, 1-025774, A | 1-4 5-7 |
| X A | US, 4741767, A (Hoffmann-La Roche, F., und Co. A.G.), 03 May, 1988 (03.05.88), Tables 1-3 & EP, 183993, A2 & JP, 61-122206, A & ES, 548913, A1 | 1-4 5-7 |
| X A | US, 4565566, A (Bayer A.G.), 21 January, 1986 (21.01.86), Examples 1 to 4 & DE, 3520390, A1 & EP, 170860, A1 & JP, 61-056181, A | 1-4 5-7 |

国際調査報告

国際出願番号 PCT/JP00/05723

A. 発明の属する分野の分類（国際特許分類（IPC））

Int.Cl' C07D491/048, 491/147, 487/04, 471/14, 487/14, 513/04, 513/14, 498/14, 498/04,
 A61K31/424, 31/437, 31/4188, 31/4985, 31/407, 31/519, 31/5377, 31/4439, 31/429, 31/5025,
 A61P3/10, 3/04

B. 調査を行った分野

調査を行った最小限資料（国際特許分類（IPC））

Int.Cl' C07D491/048, 491/147, 487/04, 471/14, 487/14, 513/04, 513/14, 498/14, 498/04,
 A61K31/424, 31/437, 31/4188, 31/4985, 31/407, 31/519, 31/5377, 31/4439, 31/429, 31/5025,
 A61P3/10, 3/04

最小限資料以外の資料で調査を行った分野に含まれるもの

国際調査で使用した電子データベース（データベースの名称、調査に使用した用語）

CAPLUS (STN), CAOLD (STN), REGISTRY (STN)

C. 関連すると認められる文献

| 引用文献の カテゴリー* | 引用文献名 及び一部の箇所が関連するときは、その関連する箇所の表示 | 関連する 請求の範囲の番号 |
|-------------------------------------|--|--|
| X A | US, 4701208, A (American Cyanamid Co.), 20.10月.1987 (20.10.87), 実施例51-52A参照 & EP, 133309, A1 & EP, 277661, A1 & ES, 534790, A1 & JP, 60-069083, A & JP, 6-116264, A | 1-5 6, 7 |
| X A | EP, 195745, A1 (CIBA-GEIGY A.G.), 24.9月.1986 (24.09.86), 表1-9参照 & JP, 61-212586, A & US, 4721522, A & US, 4726838, A & US, 4743296, A | 1-5 6, 7 |
| <input checked="" type="checkbox"/> | C欄の続きにも文献が列挙されている。 | <input type="checkbox"/> パテントファミリーに関する別紙を参照。 |

* 引用文献のカテゴリー

「A」特に関連のある文献ではなく、一般的技術水準を示すもの
 「E」国際出願日前の出願または特許であるが、国際出願日以後に公表されたもの
 「L」優先権主張に疑義を提起する文献又は他の文献の発行日若しくは他の特別な理由を確立するために引用する文献（理由を付す）
 「O」口頭による開示、使用、展示等に言及する文献
 「P」国際出願日前で、かつ優先権の主張の基礎となる出願

の日の後に公表された文献

「T」国際出願日又は優先日後に公表された文献であって出願と矛盾するものではなく、発明の原理又は理論の理解のために引用するもの
 「X」特に関連のある文献であって、当該文献のみで発明の新規性又は進歩性がないと考えられるもの
 「Y」特に関連のある文献であって、当該文献と他の1以上の文献との、当業者にとって自明である組合せによって進歩性がないと考えられるもの
 「&」同一パテントファミリー文献

| | |
|--|--|
| 国際調査を完了した日 28.11.00 | 国際調査報告の発送日 12.12.00 |
| 国際調査機関の名称及びあて先 日本国特許庁 (ISA/JP) 郵便番号100-8915 東京都千代田区霞が関三丁目4番3号 | 特許庁審査官（権限のある職員） 新留 豊 4C 9639 電話番号 03-3581-1101 内線 3'452 |

| C (続き) 関連すると認められる文献 | | |
|---------------------|---|------------------|
| 引用文献の カテゴリー* | 引用文献名 及び一部の箇所が関連するときは、その関連する箇所の表示 | 関連する 請求の範囲の番号 |
| X | JP, 63-295575, A (日産化学工業株式会社), | 1-5 |
| A | 1. 12月. 1988 (01. 12. 88), 第1表参照 (ファミリーなし) | 6, 7 |
| X | Tecle, Berhane, et al., ' Differential routes of metabolism | 1-5 |
| A | of imidazolinones: basis for soybean (Glycine max) selectivity' Pestic. Biochem. Physiol. (1993), Vol. 46, No. 2, p. 120-30, 図6参照 | 6, 7 |
| X | US, 4846876, A (Bayer A. G.), 11. 7月. 1989 (11. 07. 89), 表1参照 | 1-4 |
| A | & DE, 3634952, A1 & EP, 267412, A1 & JP, 63-112582, A | 5-7 |
| X | US, 4997947, A (Ciba-Geigy A. G.), 5. 3月. 1991 (05. 03. 91), | 1-4 |
| A | 表3. 00-3. 16及び表12. 00-12. 02参照 & EP, 296109, A2 & JP, 1-025774, A | 5-7 |
| X | US, 4741767, A (Hoffmann-La Roche, F., und Co. A. G.) | 1-4 |
| A | 3. 5月. 1988 (03. 05. 88), 表1-3参照 & EP, 183993, A2 & JP, 61-122206, A & ES, 548913, A1 | 5-7 |
| X | US, 4565566, A (Bayer A. G.), 21. 1月. 1986 (21. 01. 86), 実施例1-4参照 | 1-4 |
| A | & DE, 3520390, A1 & EP, 170860, A1 & JP, 61-056181, A | 5-7 |